

(12) NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES  
PATENTWESENS (PCT) VERÖFFENTLICHTE INTERNATIONALE ANMELDUNG

(19) Weltorganisation für geistiges Eigentum  
Internationales Büro



(43) Internationales Veröffentlichungsdatum  
6. September 2002 (06.09.2002)

PCT

(10) Internationale Veröffentlichungsnummer  
**WO 02/067684 A1**

(51) Internationale Patentklassifikation<sup>7</sup>: **A01N 43/54**,  
43/647, 43/653, 43/707, 43/76, 43/78, 43/80, C07D  
401/04, 401/14, 405/14, 409/14, 417/14, 413/14

(21) Internationales Aktenzeichen: PCT/EP02/01403

(22) Internationales Anmeldedatum:  
11. Februar 2002 (11.02.2002)

(25) Einreichungssprache: Deutsch

(26) Veröffentlichungssprache: Deutsch

(30) Angaben zur Priorität:  
101 08 481.1 22. Februar 2001 (22.02.2001) DE

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten mit Ausnahme  
von US): **BAYER AKTIENGESellschaft** [DE/DE];  
51368 Leverkusen (DE).

(72) Erfinder; und

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): **BRETSCHNEIDER**,  
Thomas [DE/DE]; Talstr. 29 b, 53797 Lohmar (DE).  
**ES-SAYED, Mazen** [DE/DE]; Ricarda-Huch-Str. 36,  
40764 Langenfeld (DE). **FISCHER, Rüdiger** [DE/DE];  
Zu den Fussfällen 23, 50259 Pulheim (DE). **MAURER**,  
Fritz [DE/DE]; Brahmstr. 36, 40789 Monheim (DE).  
**ERDELEN, Christoph** [DE/DE]; Unterbüscherhof  
15, 42799 Leichlingen (DE). **LÖSEL, Peter** [GB/DE];  
Lohrstr. 90a, 51371 Leverkusen (DE).

(74) Gemeinsamer Vertreter: **BAYER AKTIENGE-  
SELLSCHAFT**; 51368 Leverkusen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten (national): AE, AG, AL, AM, AT,  
AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR,  
CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE,

GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR,  
KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK,  
MN, MW, MX, MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU,  
SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG,  
US, UZ, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) Bestimmungsstaaten (regional): ARIPO-Patent (GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW),  
eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ,  
TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK,  
ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE, TR),  
OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW,  
ML, MR, NE, SN, TD, TG).

**Erklärung gemäß Regel 4.17:**

— hinsichtlich der Berechtigung des Anmelders, ein Patent zu  
beantragen und zu erhalten (Regel 4.17 Ziffer ii) für die  
folgenden Bestimmungsstaaten AE, AG, AL, AM, AT, AU,  
AZ, BA, BB, BG, BR, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU,  
CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH,  
GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC,  
LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX,  
MZ, NO, NZ, OM, PH, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI,  
SK, SL, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, UZ, VN, YU, ZA,  
ZM, ZW, ARIPO-Patent (GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE,  
CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL,  
PT, SE, TR), OAPI-Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA,  
GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

**Veröffentlicht:**

— mit internationalem Recherchenbericht

Zur Erklärung der Zweibuchstaben-Codes und der anderen  
Abkürzungen wird auf die Erklärungen ("Guidance Notes on  
Codes and Abbreviations") am Anfang jeder regulären Ausgabe  
der PCT-Gazette verwiesen.

(54) Title: PYRIDYL PYRIMIDINES FOR USE AS PESTICIDES

(54) Bezeichnung: PYRIDYLPYRIMIDINE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

(57) Abstract: The invention relates to novel pyridyl pyrimidines of formula (I), wherein R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n, Y, Z and R are defined as in the description. The invention further relates to several methods for producing said substances and to the use thereof as pesticides, as well as to novel intermediates and methods for producing the same.

(57) Zusammenfassung: Neue Pyridylpyrimidine der Formel (I) in welcher R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n, Y, Z und R die in der Beschreibung angegebenen Bedeutungen haben, mehrere Verfahren zur Herstellung dieser Stoffe und deren Verwendung zur Bekämpfung von Schädlingen, sowie neue Zwischenprodukte und Verfahren zu deren Herstellung.

WO 02/067684 A1

## PYRIDYLPYRIMIDINE ALS SCHÄDLINGSBEKÄMPFUNGSMITTEL

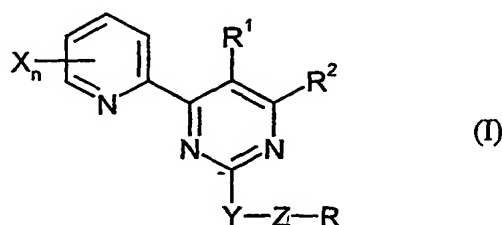
Die vorliegende Erfindung betrifft neue Pyridylpyrimidine, mehrere Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung als Schädlingsbekämpfungsmittel.

5

Es ist bereits bekannt, dass bestimmte Pyridylpyrimidin-Derivate pharmazeutische Wirkung besitzen (vgl. JP 52-71481). Andere Verbindungen dieses Typs sind als Zwischenprodukte zu fungiziden Wirkstoffen beschrieben (vgl. EP 0 471 261 B1). Wieder andere Derivate sind als Komplexligenanden bekannt (vgl. J. Chem. Soc., Dalton Trans. 1999, 3095-3101, Tetrahedron Lett. 1999, 40, 4779-4782) oder werden zur Synthese von polycyclischen Heterocyclen eingesetzt (vgl. Eur. J. Org. Chem. 1998, 2907-2912). Insektizid wirksame Pyridylpyrimidine sind bisher nicht bekannt.

15

Es wurden nun neue substituierte Pyridylpyrimidine der Formel (I)



gefunden, in welcher

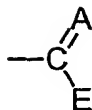
$R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy,  $-S(O)_pR^3$ ,  $-NR^4R^5$ ,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-CSR^6$ ,  $-CONR^4R^5$ ,  $-NHCO_2R^8$ , Cycloalkyl; oder für gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,

25

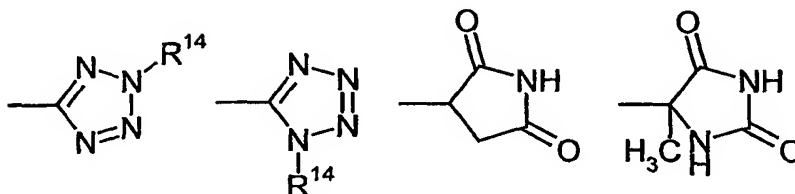
$R^1$  und  $R^2$  außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauer-

stoff unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl substituiert sein kann,

- 5 X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkinyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy,  $-S(O)_pR^3$ ,  $-NR^4R^5$ ,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-CSR^6$ ,  $-CONR^4R^5$ ,  $-NHCO_2R^8$ , Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht;
- 10 oder wenn n für 2, 3 oder 4 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann,
- 15 n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2, 3 oder 4 steht,
- 20 Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff,  $-S(O)_p-$  oder  $-NR^9-$  steht,
- p für 0, 1 oder 2 steht,
- 25 Z für  $-(CH_2)_r-$ ,  $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ ,  $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$  oder  $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$  steht,
- r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,
- t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,
- 30 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



5

steht,

- A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{NR}^{15}$  steht,
- 10 E für  $-\text{OR}^{16}$ ,  $-\text{SR}^{16}$ ,  $-\text{O}-\text{M}$ ,  $-\text{S}-\text{M}$  oder  $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$  steht,
- M für gegebenenfalls durch Alkyl, Aryl oder Arylalkyl substituiertes Ammonium oder für ein Alkalimetallion steht,
- 15 M außerdem für ein Erdalkalimetallion steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 20  $\text{R}^3$  für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,
- $\text{R}^4$  für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl oder Alkylcarbonyl steht,
- 25  $\text{R}^5$  für Wasserstoff, Amino, Formyl, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Oxamoyl steht,



R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam für Alkyliden; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen;

5 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann,

10 R<sup>6</sup> für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl oder Arylalkyl steht,

R<sup>7</sup> für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

15 R<sup>8</sup> für Alkyl oder Halogenalkyl steht,

20 R<sup>9</sup> für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

25 R<sup>10</sup> für Halogen, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für Aryl oder Arylalkyl, welche ihrerseits im Arylteil durch Halogen oder Alkyl substituiert sein können, steht,

R<sup>11</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,

30 R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl oder Alkoxy stehen,

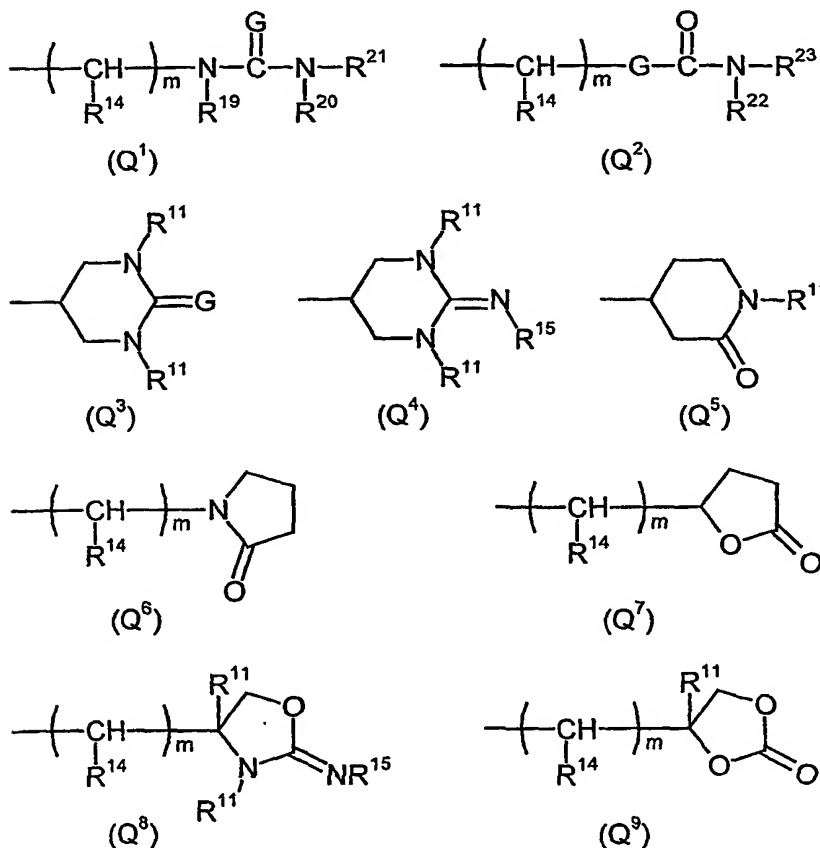
R<sup>14</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

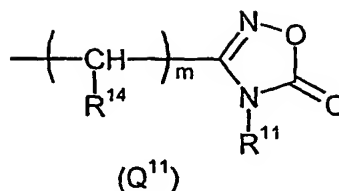
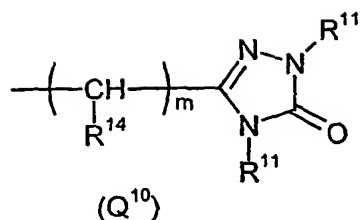
- R<sup>15</sup> für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Cyano oder Dialkylamino steht,
- 5 R<sup>16</sup> für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxy-alkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halo-genaryloxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Hetero-cyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> oder für einen der Reste Q steht,
- 10
- 15 R<sup>16</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cyclo-alkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Hete-rocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- 20
- R<sup>17</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- 25 R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebe-nenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogen-alkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cyclo-alkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht,
- 30 R<sup>18</sup> außerdem für jeweils gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl substituiertes Alkyl oder Alkenyl steht,

R<sup>18</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,

R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 bis 2 weitere Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituirt sein kann, stehen,

Q für eine der folgenden Gruppierungen





steht, wobei die Reste R<sup>11</sup> die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vor-

5

m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR<sup>14</sup>)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

10

G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R<sup>19</sup> und R<sup>20</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder gemeinsam für Alkylen stehen,

15

R<sup>21</sup> für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Alkylcarbonyloxy oder Alkoxy substituiertes Alkyl; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy carbonyl, Alkylen substituiertes Aryl steht,

20

R<sup>22</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

R<sup>23</sup> für Wasserstoff, Amino, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht.

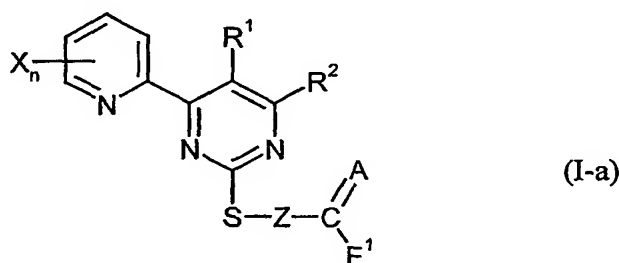
25

Die Verbindungen der Formel (I) können gegebenenfalls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten als geometrische und/oder optische Isomere bzw. Regioisomere oder deren Isomerengemische in unterschiedlicher Zusammensetzung vorliegen. Sowohl die reinen Isomere als auch die Isomerengemische werden erfindungsgemäß beansprucht. Ebenso können Verbindungen der Formel (I) gegebenen-

falls in Abhängigkeit von der Art und Anzahl der Substituenten in verschiedenen tautomeren Formen vorliegen. Alle Tautomere werden erfindungsgemäß beansprucht.

5 Ebenfalls werden erfindungsgemäß alle Pyridin- und/oder Pyrimidin-N-Oxide, die durch Verbindungen der Formel (I) gebildet werden können, beansprucht. Weiterhin fallen alle Salze von Verbindungen der Formel (I), z.B. mit Mineralsäuren wie Salzsäure, unter den Anspruch der vorliegenden Erfindung.

10 Weiterhin wurde gefunden, dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-a)



in welcher

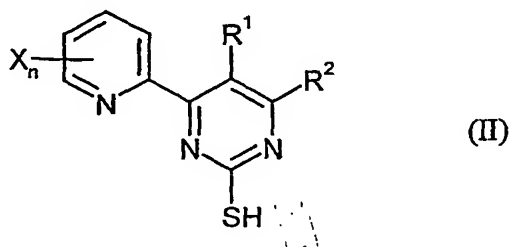
$R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

15

$E^1$  für  $-OR^{16}$ ,  $-SR^{16}$  oder  $-NR^{17}R^{18}$  steht,

erhält, indem man

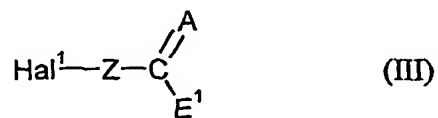
20 A) Thiole der Formel (II)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Halogen-Verbindungen der Formel (III)



in welcher

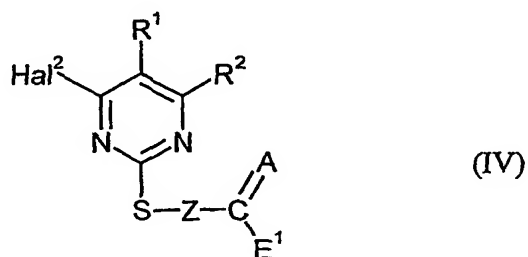
Z, A und  $E^1$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$\text{Hal}^1$  für Halogen steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

oder

B) Halogenpyrimidine der Formel (IV)



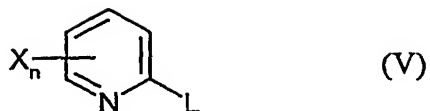
in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , Z, A und  $E^1$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$\text{Hal}^2$  für Halogen steht,

mit Pyridin-Verbindungen der Formel (V)

- 10 -



in welcher

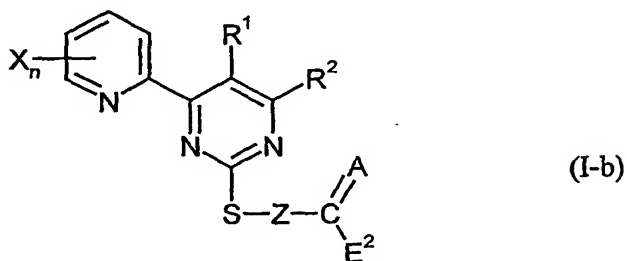
5 X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben und

L für  $\text{Sn(Alkyl)}_3$ ,  $\text{Sn(Aryl)}_3$ ,  $\text{ZnBr}$  oder  $\text{ZnCl}$  steht,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart  
 10 eines Katalysators umsetzt,

oder

C) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-b)



15

in welcher

$\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ , X, n, Z und A die oben angegebenen Bedeutungen haben und

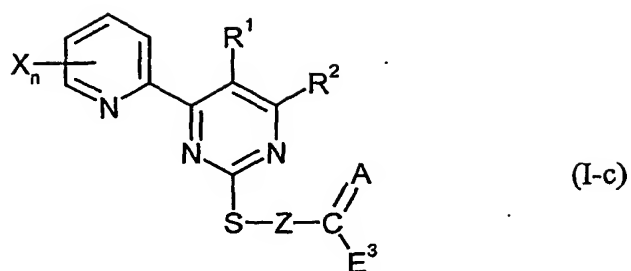
20  $\text{E}^2$  für  $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$  steht,

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-c)

25

- 11 -



in welcher

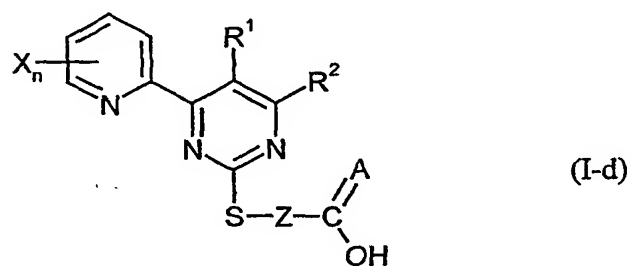
$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $A$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

5

$E^3$  für  $-OR^{16}$  steht, wobei  $R^{16}$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

in einer ersten Stufe gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels  
mit einer Base behandelt und die entstandene Verbindung der Formel (I-d)

10

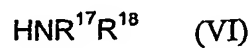


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $A$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15

in einer zweiten Stufe mit Aminen der Formel (VI)



20

in welcher

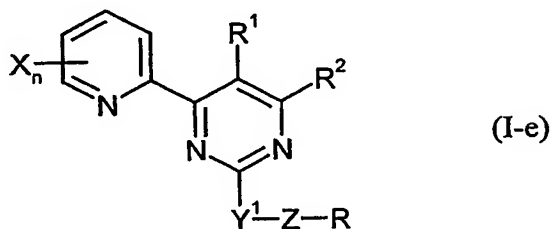
$R^{17}$  und  $R^{18}$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,



gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines wasserabsorbierenden Reagenzes umgesetzt,

5 oder

D) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-e)



10 in welcher

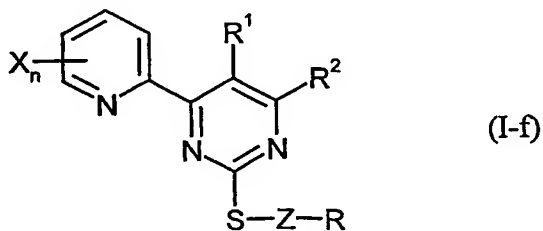
$R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$Y^1$  für -SO- oder -SO<sub>2</sub>- steht,

15

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-f)



20

in welcher

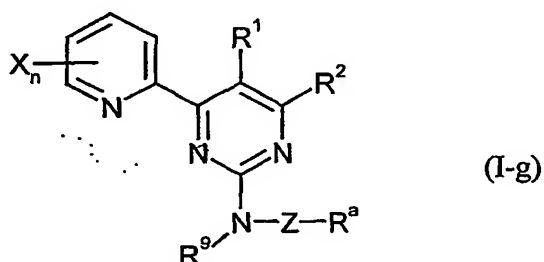
$R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einem Oxidationsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oxidiert,

oder

5

E) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-g)

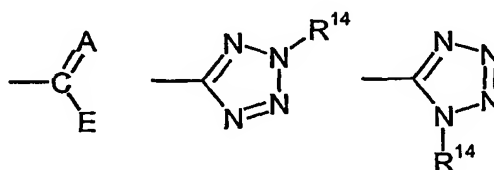


in welcher

10

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R^9$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$R^a$  für eine der folgenden Gruppierungen steht



15

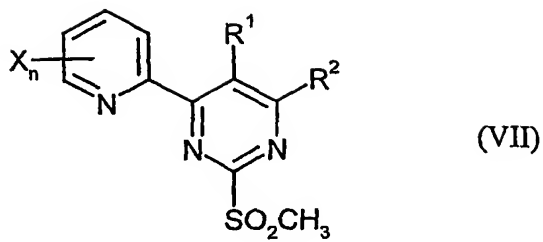
in welcher

$R^{14}$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20

erhält, indem man

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Aminen der Formel (VIII)



in welcher

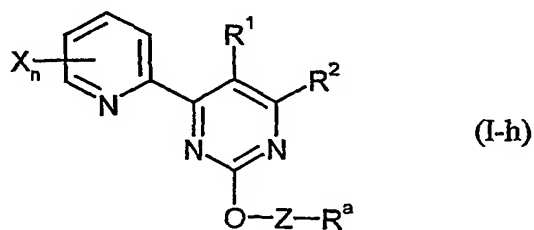
10

Z,  $R^9$  und  $R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

15 oder

F) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-h)

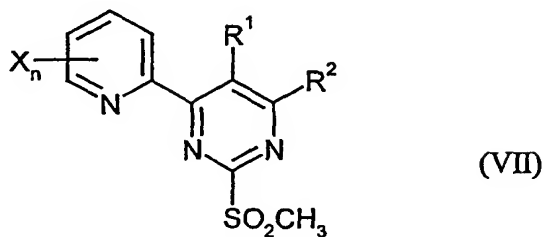


20 in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und  $R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



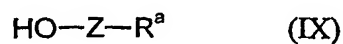
5

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

10

mit Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX)



in welcher

15

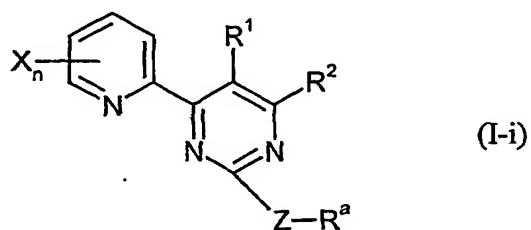
Z und  $R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

oder

20

G) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-i)



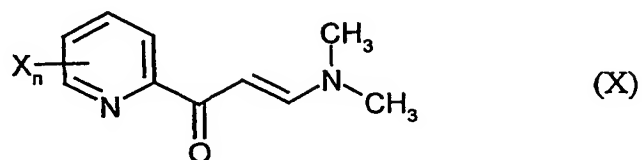
in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und  $R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

erhält, indem man

Pyridin-Derivate der Formel (X)



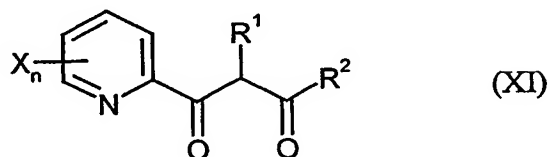
10

in welcher

X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

oder Pyridin-Derivate der Formel (XI)

15

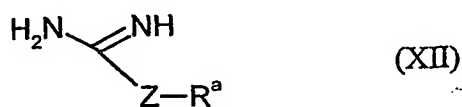


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

mit Amidinen der Formel (XII)



25

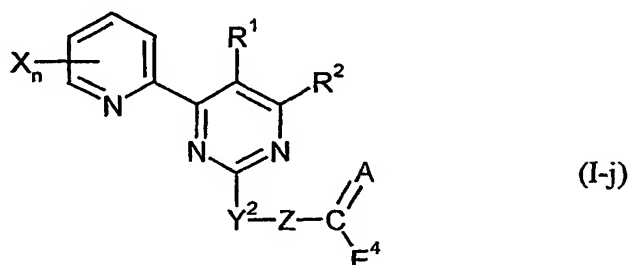
in welcher

Z und R<sup>a</sup> die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umsetzt,

5 oder

H) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-j)



10 in welcher

Y<sup>2</sup> für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR<sup>9</sup>- steht,

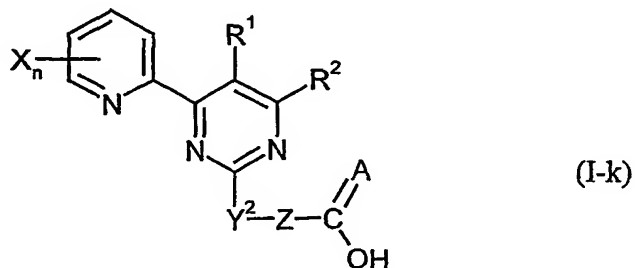
E<sup>4</sup> für -O-M oder -S-M steht und

15

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n, Z, A und M die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

20 Pyridylpyrimidine der Formel (I-k)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Y^2$ ,  $Z$  und  $A$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5 mit Hydroxiden der Formel (XIII)



in welcher

10

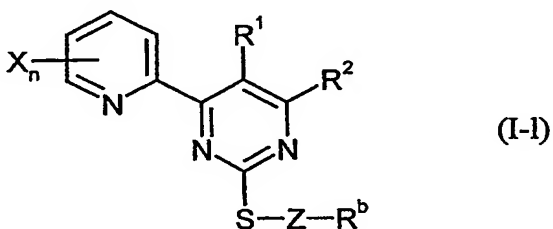
$M$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umsetzt,

oder

15

J) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-I)

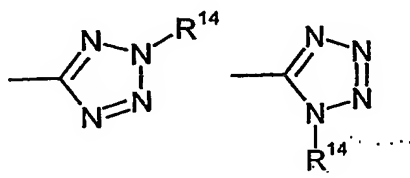


in welcher

20

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Y$  und  $Z$  die oben angegebenen Bedeutungen haben und

$R^b$  für eine der folgenden Gruppierungen steht

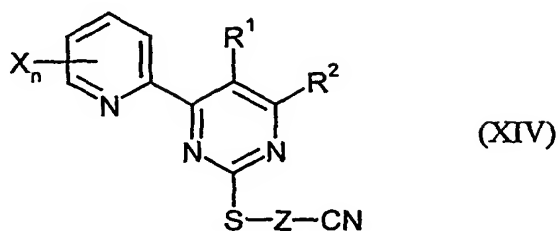


25

worin  $R^{14}$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

5 Nitrile der Formel (XIV)



in welcher

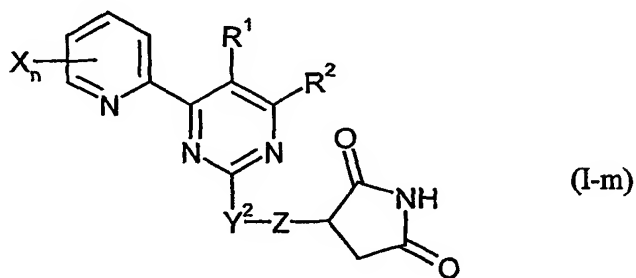
10  $R^1$ ,  $R^2$ , X, n und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit Trialkylzinnaziden gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

15

K) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-m)



in welcher

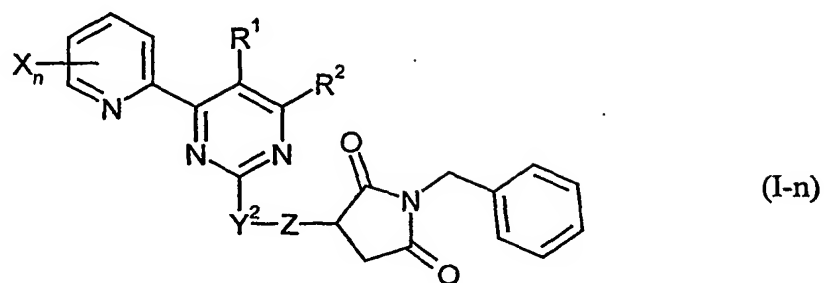
20

$R^1$ ,  $R^2$ , X, n,  $Y^2$  und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man



Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)



in welcher

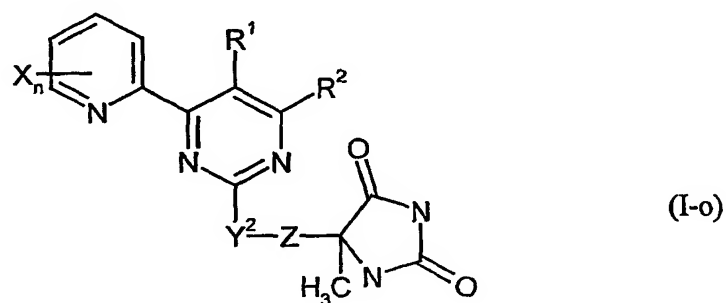
5

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Y^2$  und  $Z$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

10 oder

L) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-o)



15

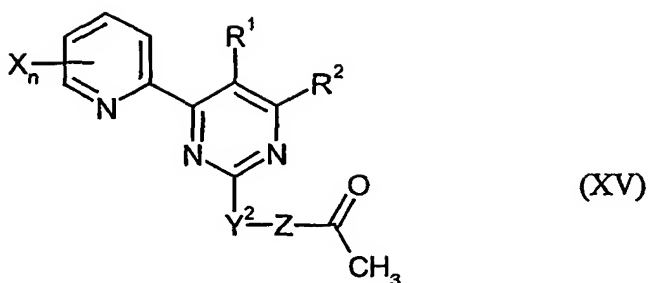
in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Y^2$  und  $Z$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

20

Keto-Verbindungen der Formel (XV)



in welcher

5  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Y^2$  und  $Z$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Ammoniumcarbonat und Kaliumcyanid gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

10 Schließlich wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) sehr gute insektizide Eigenschaften besitzen und sich sowohl im Pflanzenschutz als auch im Materialschutz zur Bekämpfung unerwünschter Schädlinge, wie Insekten, verwenden lassen. Über insektizide Wirksamkeit von Pyridylpyrimidinen ist aus dem Stand der Technik bisher nichts bekannt.

15 Die erfindungsgemäßen Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I) allgemein definiert.

20  $R^1$  und  $R^2$  stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkinyloxy,  $-S(O)_pR^3$ ,  $-NR^4R^5$ ,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-CSR^6$ ,  $-CONR^4R^5$ ,  $-NHCO_2R^8$ ,  $C_3$ - $C_7$ -Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy substituiertes Aryl, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl oder 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder un-

25

gesättigtes Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält.

- 5  $R^1$  und  $R^2$  stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für  $C_3$ - $C_5$ -Alkylen oder  $C_3$ - $C_4$ -Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl substituiert sein kann.
- 10
- X steht bevorzugt für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkynyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkenyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Alkinyloxy,  $C_2$ - $C_6$ -Halogenalkinyloxy,  $-S(O)_pR^3$ ,  $-NR^4R^5$ ,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-CSR^6$ ,  $-CONR^4R^5$ ,  $-NHCO_2R^8$ ,  $C_3$ - $C_7$ -Cycloalkyl, Aryl, Aryl- $C_1$ - $C_6$ -alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält;
- 15
- 20
- oder wenn n für 2 oder 3 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam bevorzugt für  $C_3$ - $C_5$ -Alkylen oder  $C_3$ - $C_4$ -Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann.
- 25
- n steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 oder 3 steht.
- 30
- Y steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff,  $-S(O)_p$ - oder  $-NR^9$ -.
- p steht bevorzugt für 0, 1 oder 2.

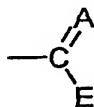
Z steht bevorzugt für  $-(CH_2)_r$ ,  $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w$ ,  
 $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t$ ,  $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t$ ,  $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t$ ,  
 $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t$  oder  $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w$ .

5

r steht bevorzugt für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6.

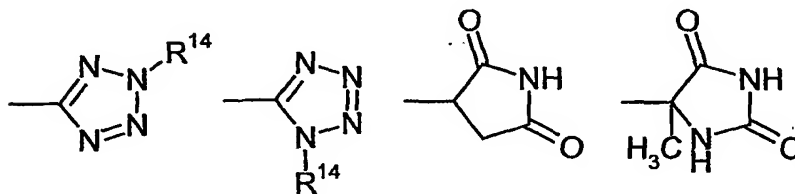
t und w stehen unabhängig voneinander bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.

10 R steht bevorzugt für die Gruppierung



15

oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



20

A steht bevorzugt für Sauerstoff, Schwefel oder  $NR^{15}$ .

E steht bevorzugt für  $-OR^{16}$ ,  $-SR^{16}$ ,  $-O-M$ ,  $-S-M$  oder  $-NR^{17}R^{18}$ .

25

M steht bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch  $C_1-C_6$ -Alkyl, Aryl oder Aryl- $C_1-C_6$ -alkyl substituiertes Ammonium oder für ein Lithiumkation ( $Li^+$ ), ein Natriumkation ( $Na^+$ ) oder ein Kaliumkation ( $K^+$ ).

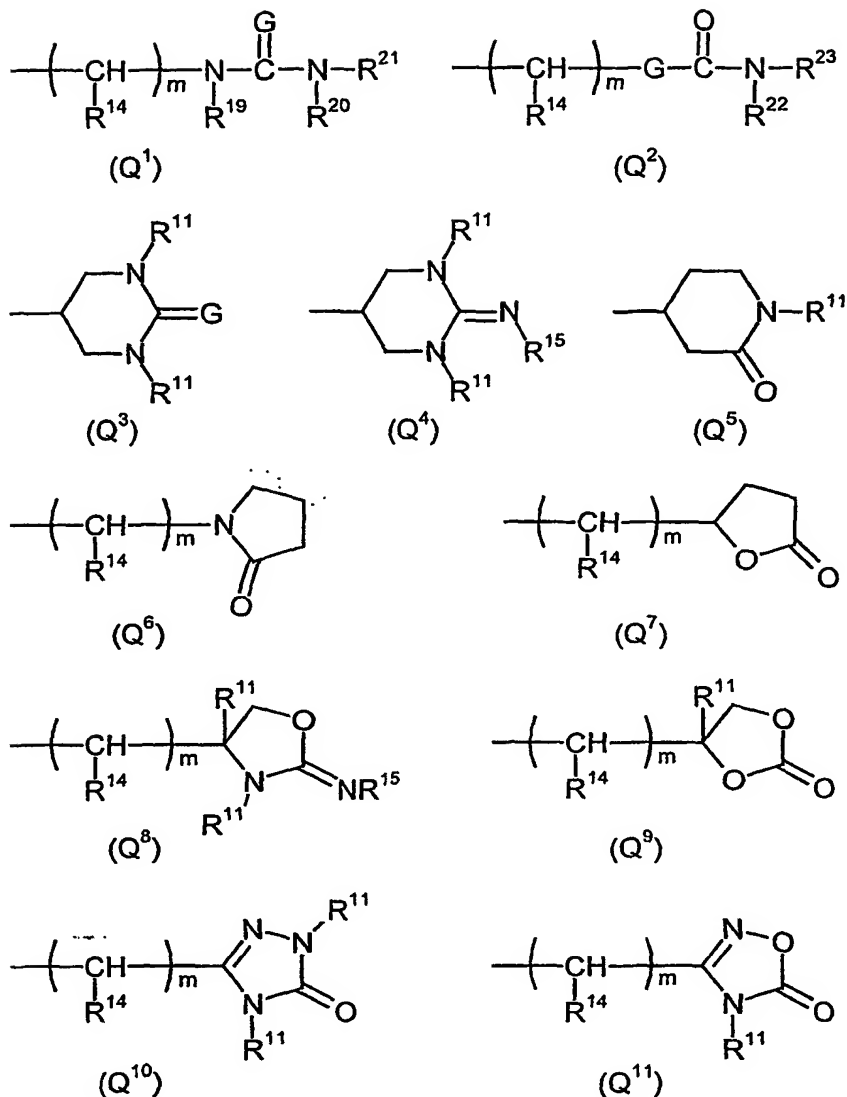
- M steht außerdem bevorzugt für ein Magnesiumkation ( $Mg^{2+}$ ) oder ein Calciumkation ( $Ca^{2+}$ ), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 5 R<sup>3</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 10
- 15 R<sup>4</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl.
- R<sup>5</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, Oxamoyl.
- 20
- R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> stehen außerdem gemeinsam bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl substituiertes Benzyliden.
- 25
- R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocylus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl substituiert sein kann.
- 30

- R<sup>6</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl.
- 5 R<sup>7</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl.
- R<sup>8</sup> steht bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl.
- 10 R<sup>9</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 15
- 20 R<sup>10</sup> steht bevorzugt für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl substituiert sein können.
- 25 R<sup>11</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl.
- R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy.
- 30 R<sup>14</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl.

- R<sup>15</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Cyano oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino.
- 5 R<sup>16</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, 10 -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> oder für einen 20 der Reste Q.
- R<sup>16</sup> steht außerdem bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 25 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.
- 30 R<sup>17</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl...

- 5  
10  
15  
20  
25  
30
- R<sup>18</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylen)oxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>.
- R<sup>18</sup> steht außerdem bevorzugt für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxycarbonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl.
- R<sup>18</sup> steht außerdem bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können.
- R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl substituiert sein kann.
- Q steht bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen





5

wobei die Reste R<sup>11</sup> die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

10

m steht bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit  $\text{---}(\text{CHR}^{14})\text{---}$  innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.

15

G steht bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

R<sup>19</sup> und R<sup>20</sup> stehen unabhängig voneinander bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder gemeinsam für C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylen.

5      R<sup>21</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylen substituiertes Aryl.

R<sup>22</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl.

15      R<sup>23</sup> steht bevorzugt für Wasserstoff, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl.

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1  
20 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -COR<sup>6</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -CSR<sup>6</sup>, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NHCO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls  
25 einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome,  
30 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält.

- R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylen oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.
- 5
- X steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -COR<sup>6</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -CSR<sup>6</sup>, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NHCO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefel-  
 10  
 15 atome enthält;
- oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylen oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann.
- 20
- 25 n steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht.
- Y steht besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)<sub>p</sub>- oder -NR<sup>9</sup>-.
- 30
- p steht besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

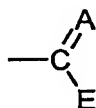
Z steht besonders bevorzugt für  $-(CH_2)_r-$ ,  $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ ,  $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$  oder  $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$ .

5 r steht besonders bevorzugt für 1, 2, 3 oder 4.

t und w stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für 0, 1, 2, 3 oder 4.

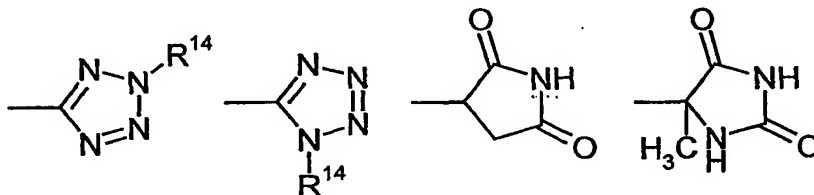
R steht besonders bevorzugt für die Gruppierung

10



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe

15



A steht besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

20 E steht besonders bevorzugt für  $-OR^{16}$ ,  $-SR^{16}$ ,  $-O-M$ ,  $-S-M$  oder  $-NR^{17}R^{18}$ .

M steht besonders bevorzugt für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl, Phenyl, Benzyl oder Phenylethyl substituiertes Ammonium oder für ein Natriumkation ( $Na^+$ ) oder ein Kaliumkation ( $K^+$ ).

25

- M steht außerdem besonders bevorzugt für ein Magnesiumkation ( $Mg^{2+}$ ) oder ein Calciumkation ( $Ca^{2+}$ ), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 5 R<sup>3</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 10
- 15
- R<sup>4</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl:
- 20
- R<sup>5</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Oxamoyl.
- 25
- R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> stehen außerdem gemeinsam besonders bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Benzyliden.
- 30
- R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder un-

gesättigten Heterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

- 5      R<sup>6</sup>    steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl.
- 10      R<sup>7</sup>    steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl.
- 15      R<sup>8</sup>    steht besonders bevorzugt für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 20      R<sup>9</sup>    steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten.
- 25      R<sup>10</sup>    steht besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Iod, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein können.
- 30

- R<sup>11</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.
- R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy.
- 5 R<sup>14</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen.
- 10 R<sup>15</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Cyano oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino.
- 15 R<sup>16</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>,  
 20 -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, Decenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3  
 25 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q.
- 30

- R<sup>16</sup> steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, Decenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkinyl.
- 5
- R<sup>16</sup> steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche
- 10 jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.
- 15 R<sup>17</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.
- R<sup>18</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylen)oxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>.
- 20
- 25
- 30 R<sup>18</sup> steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-,



Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxy-carbonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl.

5

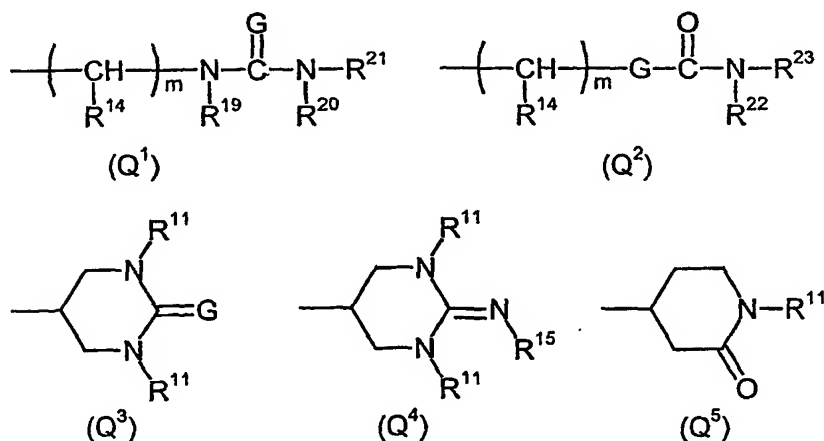
R<sup>18</sup> steht außerdem besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können.

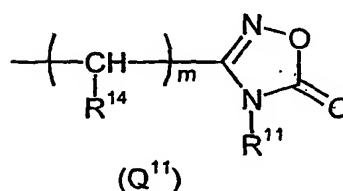
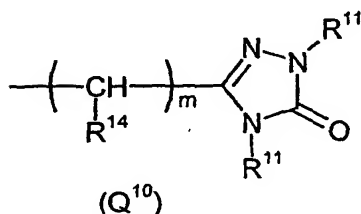
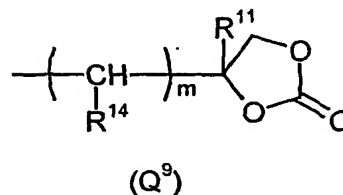
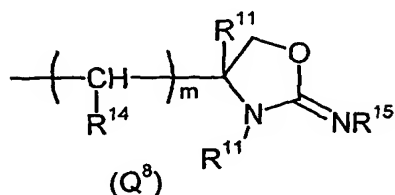
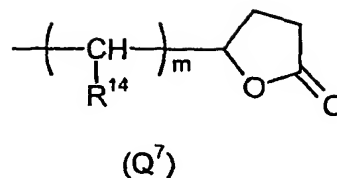
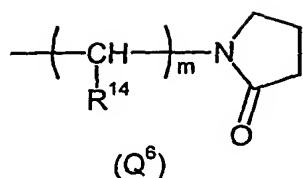
10

R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann.

20

Q steht besonders bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen





5           wobei die Reste R<sup>11</sup> die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

10           m       steht besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR<sup>14</sup>)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.

15           G       steht besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

          R<sup>19</sup> und R<sup>20</sup> stehen unabhängig voneinander besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder gemeinsam für C<sub>2</sub>-C<sub>3</sub>-Alkylen.

20           R<sup>21</sup>   steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach bis zweifach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen,

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylen substituiertes Aryl.

5 R<sup>22</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl.

R<sup>23</sup> steht besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl.

10 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CHCl<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, 15 -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SCHF<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>Me, -SO<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -SOCHF<sub>2</sub>, -SOCF<sub>3</sub>, -COMe, -CO<sub>2</sub>Me, -CO<sub>2</sub>Et, Amino, Cyclopentyl, Cyclohexyl; jeweils gegebenenfalls durch Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Pyridinyl, 20 Furyl, Furfuryl.

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> stehen außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-, -CH=CH-N=CH-, -CH=CCl-CH=CH-.

25

X steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CHCl<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -SCF<sub>3</sub>, -SCHF<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>Me, -SO<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, -SO<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -SOCHF<sub>2</sub>, -SOCF<sub>3</sub>, -CH=CH<sub>2</sub>, -C≡CH, Amino, 30

5 -NHMe, -NMe<sub>2</sub>, -CHO, -COMe, -CO<sub>2</sub>Me, -CO<sub>2</sub>Et, -NHCOMe, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazolyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl; oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-NH-CH<sub>2</sub>-, -CH=CH-N=CH-.

X steht außerdem ganz besonders bevorzugt für Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, i-Propylthio.

10 n steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht.

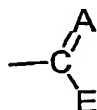
15 Y steht ganz besonders bevorzugt für eine direkte Bindung, Sauerstoff, -S(O)<sub>p</sub>- oder -NR<sup>9</sup>-.

p steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1 oder 2.

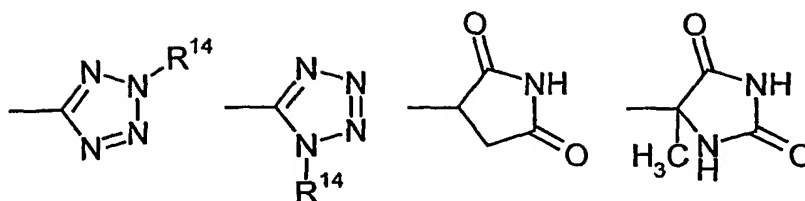
20 Z steht ganz besonders bevorzugt für -CH<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>-, -(CHR<sup>10</sup>)-, -CH<sub>2</sub>-C(O)-CH<sub>2</sub>-, -CH<sub>2</sub>-NH-, -CH=CH-, -CH<sub>2</sub>-CH=CH-, -CH=C(OH)-, -CH=C(OMe)-, -CH<sub>2</sub>-C(OMe)=CH-.

Z steht außerdem ganz besonders bevorzugt für -CH<sub>2</sub>-C(OEt)=CH-.

25 R steht ganz besonders bevorzugt für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe



- A steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.
- 5 E steht ganz besonders bevorzugt für  $-OR^{16}$ ,  $-SR^{16}$ ,  $-O-M$  oder  $-NR^{17}R^{18}$ .
- M steht ganz besonders bevorzugt für Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium oder für ein Natriumkation ( $Na^+$ ) oder ein Kaliumkation ( $K^+$ ).
- 10 M steht außerdem ganz besonders bevorzugt für ein Magnesiumkation ( $Mg^{2+}$ ) oder ein Calciumkation ( $Ca^{2+}$ ), wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden.
- 15 R<sup>4</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe.
- R<sup>5</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Formyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Propargyl, Methoxy, Methoxymethyl, -COMe, -COEt, t-Butoxycarbonyl, Oxamoyl.
- 20 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> stehen außerdem gemeinsam ganz besonders bevorzugt für Ethyliden, i-Propyliden, s-Butyliden, Nitrobenzyliden.
- 25 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ganz besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Piperidin, Thiomorpholin, Pyrrolidin, Tetrahydropyridin, der gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl substituiert sein kann.

- 5  
10  
15  
20  
25  
30
- R<sup>8</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CHCl<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCI, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H oder für -CF<sub>2</sub>CHFCF<sub>3</sub>.
- R<sup>9</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl.
- R<sup>10</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe, -COEt, -CO<sub>2</sub>Me, -CO<sub>2</sub>Et, Cyclohexyl; Phenyl oder Benzyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiert sein können.
- R<sup>11</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl.
- R<sup>14</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl oder t-Butyl.
- R<sup>15</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl oder Cyano.
- R<sup>16</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -CH=N-OCH<sub>3</sub> substituiertes Methyl, Ethyl,

n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl,  
 Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl,  
 Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder  
 für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch  
 5 Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl,  
 i-Butyl, t-Butyl,  $-CF_3$ ,  $-CCl_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CClF_2$ ,  $-CHCl_2$ ,  $-CF_2CHFCI$ ,  
 $-CF_2CH_2F$ ,  $-CF_2CCl_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CF_2CHFCF_3$ ,  $-CH_2CF_2H$ ,  $-CH_2CF_2CF_3$ ,  
 $-CF_2CF_2H$ ,  $-CF_2CHFCF_3$ , Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-  
 methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio,  $-CO_2Me$ ,  
 10  $-CO_2Et$ , Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl, Benzyl,  
 Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropyl-  
 methyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclo-  
 propylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl,  
 Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxa-  
 15 zyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl,  
 Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanyl-  
 methyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl,  
 Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazylmethyl, Imidazo-  
 20 lylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinyl-  
 methyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydro-  
 pyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazo-  
 lanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl,  
 Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl,  
 Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinyl-  
 25 ethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxid-  
 ethyl; oder für einen der Reste Q.

R<sup>16</sup> steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls bis zur  
 maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor  
 30 und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl,  
 s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl,

n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl.

5 R<sup>16</sup> steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenyl-  
ethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, 10 Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydro-  
15 pyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxid-  
20 ethyl, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können.

R<sup>17</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl.

25

R<sup>18</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluor-  
30 methoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH<sub>2</sub>-O- substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyri-



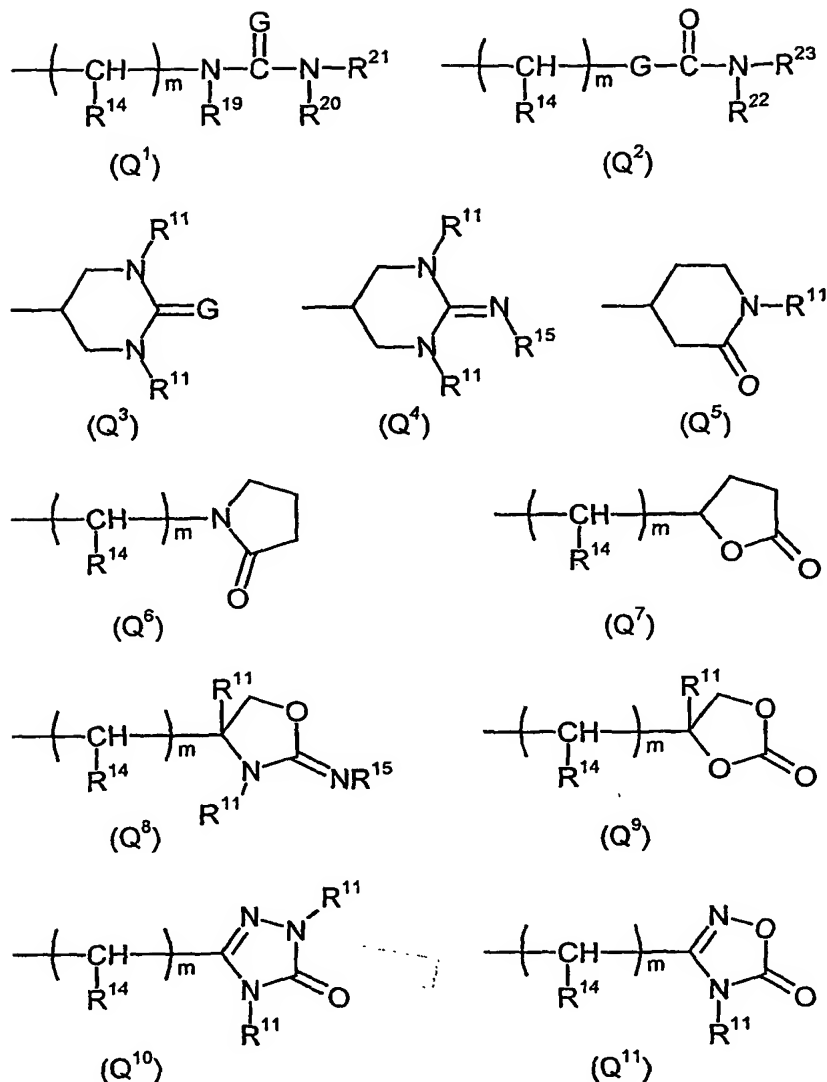
dinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für -SO<sub>2</sub>Me, -SO<sub>2</sub>Et oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>.

5            R<sup>18</sup> steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, 10            t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl.

15            R<sup>18</sup> steht außerdem ganz besonders bevorzugt für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl, wobei die Substituenten zusätzlich zu den 20            oben genannten aus Nitro, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl ausgewählt werden können.

             R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> stehen außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, ganz besonders bevorzugt für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Piperazin, Morpholin, Piperidin, Pyrrolidin, welcher 25            gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl substituiert sein kann.

             Q steht ganz besonders bevorzugt für eine der folgenden Gruppierungen



5

wobei die Reste R<sup>11</sup> die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen.

10

m steht ganz besonders bevorzugt für 0, 1, 2 oder 3, wobei die Wiederholungseinheit  $\text{---}(\text{CHR}^{14})\text{---}$  innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht.

15

G steht ganz besonders bevorzugt für Sauerstoff oder Schwefel.

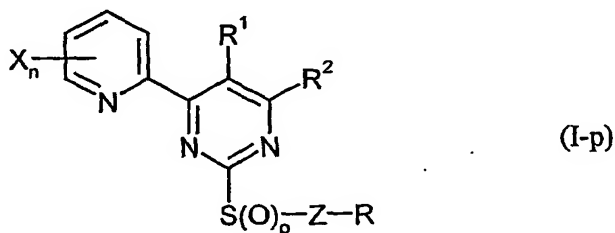
R<sup>19</sup> und R<sup>20</sup> stehen unabhängig voneinander ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, oder gemeinsam für -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>-.

5 R<sup>21</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach durch t-Butylcarbonyloxy oder Methoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Chlor, Cyano, Methyl, Ethyl, t-Butyl, Trifluormethyl, s-Butyloxycarbonyl, 10 t-Butyloxycarbonyl, n-Octyloxycarbonyl, -(CH<sub>2</sub>)<sub>4</sub>- substituiertes Phenyl.

R<sup>22</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Methoxymethyl.

15 R<sup>23</sup> steht ganz besonders bevorzugt für Wasserstoff, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl oder Methoxymethyl.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-p)

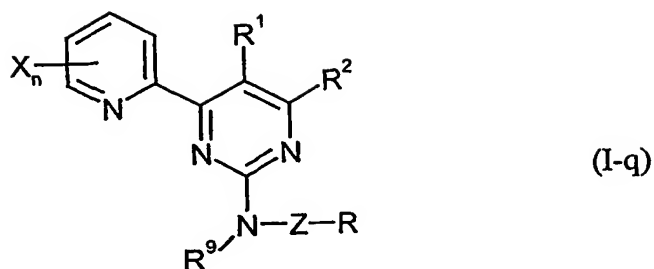


20

in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n, p, Z und R die oben angegebenen Bedeutungen haben.

25 Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-q)

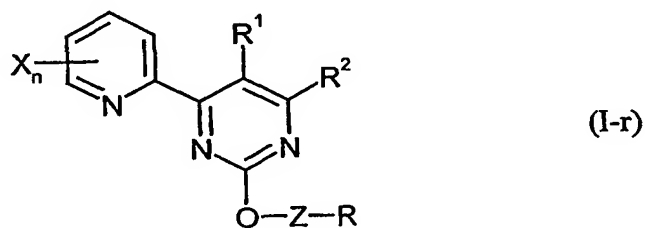


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$ ,  $R$  und  $R^9$  die oben angegebenen Bedeutungen haben.

5

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-r)

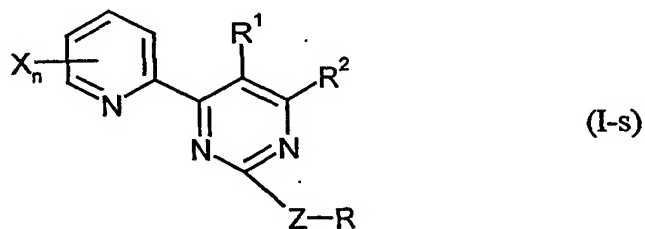


in welcher

10

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R$  die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-s)

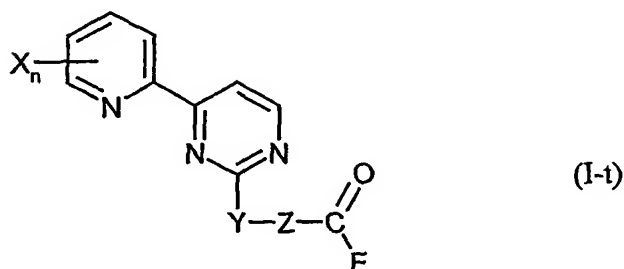


15

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R$  die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Insbesondere ganz besonders bevorzugt sind Pyridylpyrimidine der Formel (I-t)



in welcher

5

X für Methyl, Ethyl, Chlor, Brom,  $-CF_3$ , Methoxy oder Trifluormethoxy steht,

n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,

10

Y für -S- oder  $-NR^9$ - steht,

Z für  $-CH_2-$  oder  $-(CH_2)_2-$  steht,

15

E für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, i-Butoxy, s-Butoxy, t-Butoxy,  $-NH-SO_2Me$  oder  $-NH-SO_2Et$  steht,

$R^9$  für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

20

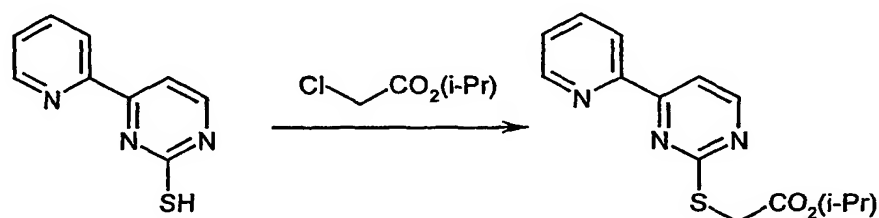
Gesättigte Kohlenwasserstoffreste wie Alkyl können, auch in Verbindung mit Heteroatomen, wie z.B. in Alkoxy, soweit möglich, jeweils geradkettig oder verzweigt sein.

25

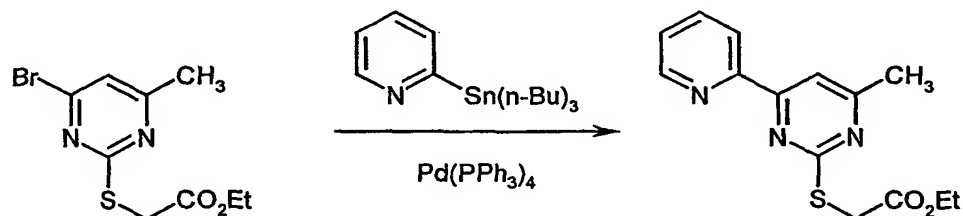
Die oben aufgeführten allgemeinen oder in Vorzugsbereichen aufgeführten Restdefinitionen bzw. Erläuterungen können jedoch auch untereinander, also zwischen den jeweiligen Bereichen und Vorzugsbereichen beliebig kombiniert

werden. Sie gelten für die Endprodukte sowie für die Vor- und Zwischenprodukte entsprechend.

5 Verwendet man 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinylthiol und 2-Chloressigsäureisopropylester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

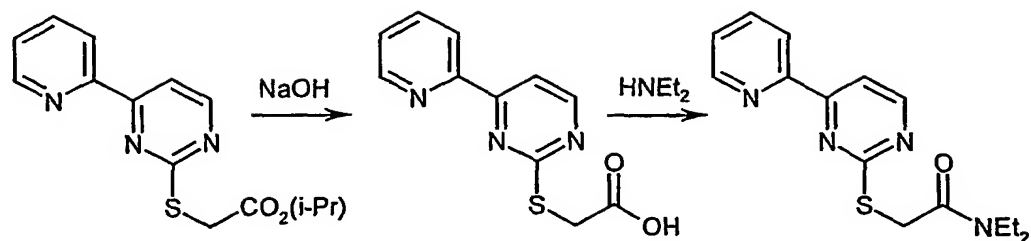


10 Verwendet man Ethyl-[(4-brom-6-methyl-2-pyrimidinyl)thio]acetat, 2-(Tributylstannyl)pyridin und einen Palladium-Katalysator als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

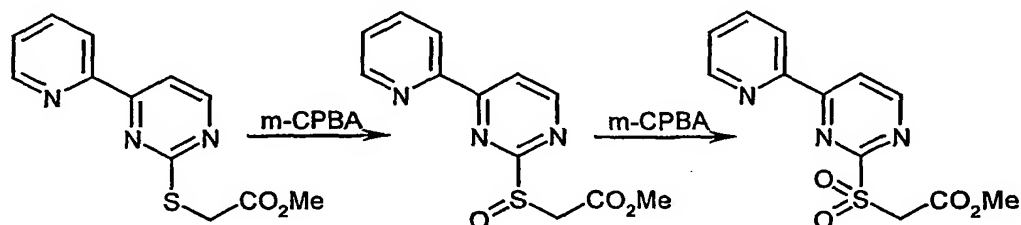


15

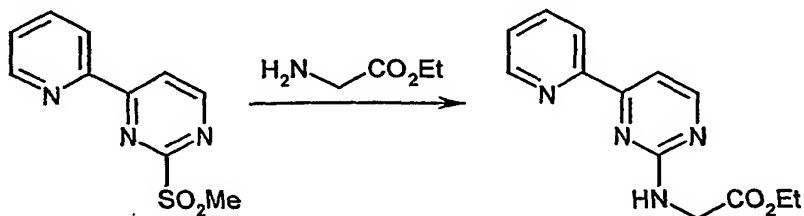
20 Verwendet man Isopropyl-[[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio]acetat als Ausgangsstoff und Natronlauge und Diethylamin als Reaktionshilfsmittel, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



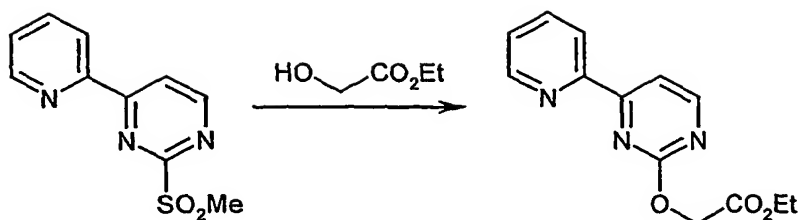
- Verwendet man Methyl-{{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetat als Ausgangs-  
stoff und meta-Chlorperbenzoesäure (m-CPBA) als Oxidationsmittel, so kann der  
Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) durch das folgende Formelschema  
veranschaulicht werden.



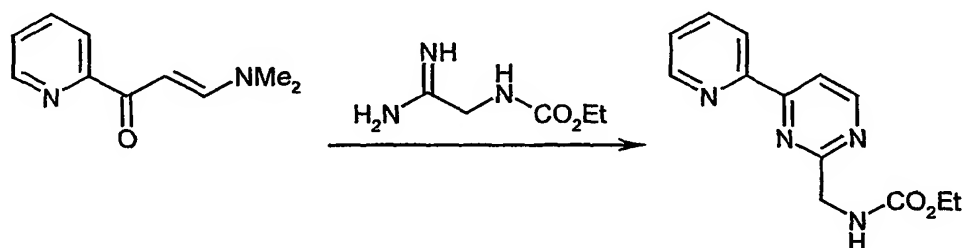
- Verwendet man 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und Glycinethylester  
als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (E)  
durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



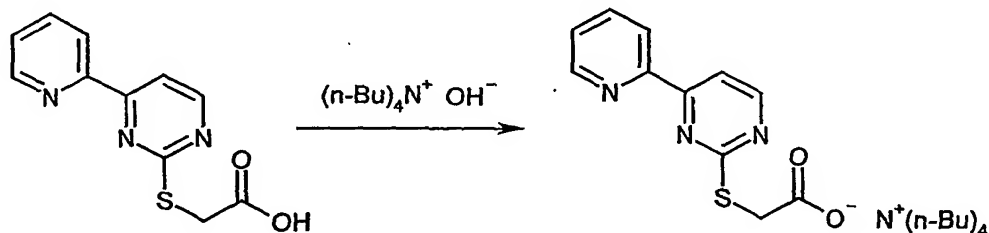
- Verwendet man 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und Glykolsäureethyl-  
ester als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (F)  
durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



- Verwendet man 3-(Dimethyl-amino)-1-(2-pyridinyl)-2-propen-1-on und Methyl-2-amino-2-iminoethylcarbammat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

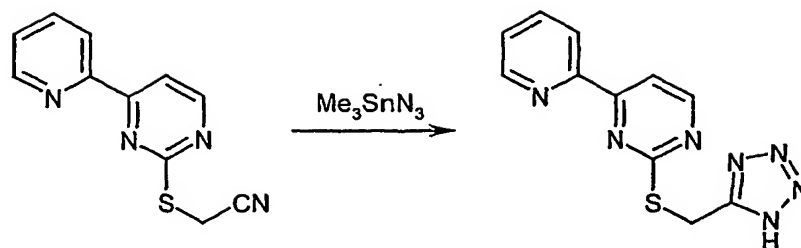


- Verwendet man {[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}essigsäure und Tetrabutylammoniumhydroxid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

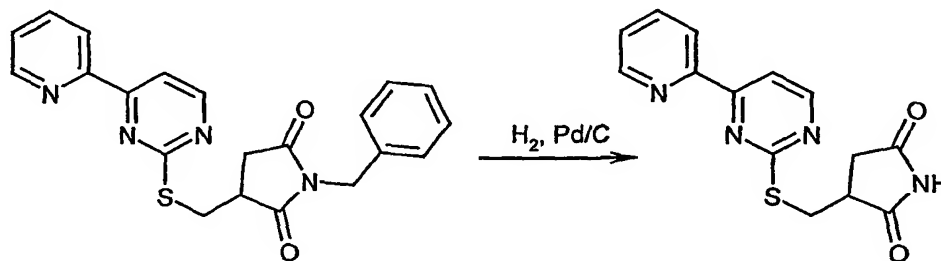


- Verwendet man {[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetonitril und Trimethylzinnazid als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.

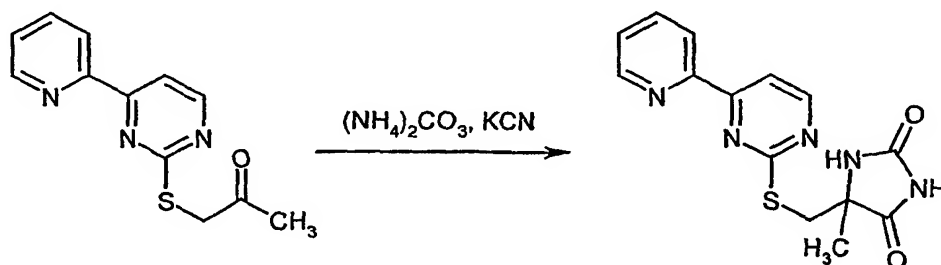




- Verwendet man 1-Benzyl-3-({[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}methyl)-2,5-pyrrolidindion und Wasserstoff als Ausgangsstoffe, sowie Palladium/Aktivkohle als Katalysator, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



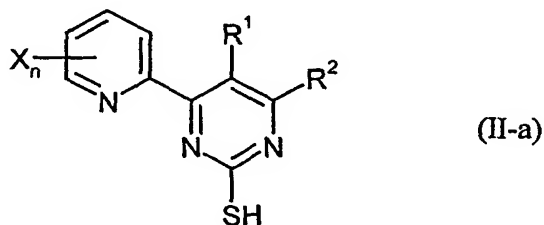
- Verwendet man 1-({[4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetone, Kaliumcyanid und Ammoniumcarbonat als Ausgangsstoffe, so kann der Verlauf des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) durch das folgende Formelschema veranschaulicht werden.



Erläuterung der Verfahren und ZwischenprodukteVerfahren (A)

- 5 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) als Ausgangsstoffe benötigten Thiole sind durch die Formel (II) allgemein definiert. In dieser Formel stehen  $R^1$ ,  $R^2$ , X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als
- 10 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Die Thiole der Formel (II-a)

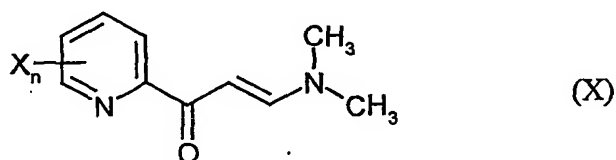


- 15 in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben mit der Maßgabe, dass wenigstens einer der Reste  $R^1$ ,  $R^2$  oder X nicht für Wasserstoff steht,

- 20 sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

a) Pyridin-Derivate der Formel (X)



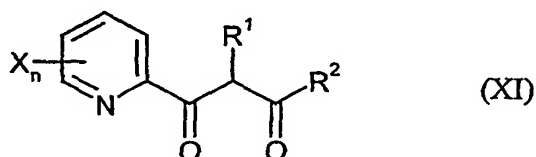
- 25 in welcher

X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Thioharnstoff gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels  
(z.B. Methanol, Wasser) und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base (z.B.  
5 Natriumhydroxid, Natriumethanolat) umsetzt,

oder

b) Pyridin-Derivate der Formel (XI)



in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

15 mit Thioharnstoff gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels  
(z.B. Methanol, Wasser) und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base (z.B.  
Natriumhydroxid, Natriumethanolat) oder einer Säure (z.B. Salzsäure oder  
Trifluoressigsäure) umsetzt.

20 Die bei der Durchführung der Verfahren (a) und (b) als Ausgangsstoffe benötigten  
Pyridin-Derivate sind durch die Formeln (X) und (XI) allgemein definiert. In diesen  
Formeln stehen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz  
besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit  
der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als  
25 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Pyridin-Derivate der Formeln (X) und (XI) sind bekannt und/oder lassen sich nach  
bekannten Verfahren herstellen (vgl. J. Chem. Soc., Dalton Trans. 1999, 3095,  
J. Amer. Chem. Soc. 1951, 73, 5614).

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) als Ausgangsstoffe benötigten Halogen-Verbindungen sind durch die Formel (III) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. E<sup>1</sup> steht bevorzugt für -OR<sup>16</sup>, -SR<sup>16</sup> oder -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>, besonders bevorzugt für -OR<sup>16</sup> oder -SR<sup>16</sup>, wobei R<sup>16</sup>, R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> jeweils bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. Hal<sup>1</sup> steht bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, besonders bevorzugt für Chlor oder Brom.

Halogen-Verbindungen der Formel (III) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Acetonitril oder Dimethylformamid.

Als Säurebindemittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $200^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $150^{\circ}\text{C}$ , ganz besonders bevorzugt zwischen  $20^{\circ}\text{C}$  und  $100^{\circ}\text{C}$ .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (II) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (III), sowie 1-10 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

#### Verfahren (B)

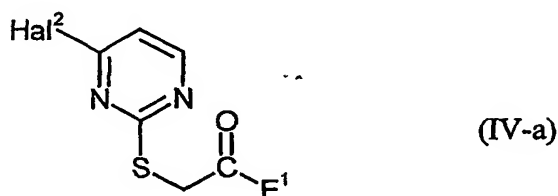
Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Halogenpyrimidine sind durch die Formel (IV) allgemein definiert. In

dieser Formel stehen  $R^1$ ,  $R^2$ , Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.  $E^1$  steht bevorzugt für  $-OR^{16}$ ,  
5  $-SR^{16}$  oder  $-NR^{17}R^{18}$ , besonders bevorzugt für  $-OR^{16}$  oder  $-SR^{16}$ , wobei  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  und  $R^{18}$  jeweils bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.  $Hal^2$  steht bevorzugt für Fluor, Chlor, Brom oder Iod,  
10 besonders bevorzugt für Chlor, Brom oder Iod, ganz besonders bevorzugt für Chlor oder Brom.

Die Halogenpyrimidine der Formel (IV) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen (vgl. US 3,910,910).

15

Halogenpyrimidine der Formel (IV-a)



in welcher

20

- a)  $E^1$  für Methoxy oder Ethoxy steht und  
 $Hal^2$  für Brom steht,

oder

25

- b)  $E^1$  für Methoxy steht und  
 $Hal^2$  für Chlor steht,

sind neu.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridin-Verbindungen sind durch die Formel (V) allgemein definiert. In dieser Formel stehen X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als  
5 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden. L steht bevorzugt für Sn(n-Bu)<sub>3</sub>, Sn(Me)<sub>3</sub>, Sn(Phenyl)<sub>3</sub>, ZnBr oder ZnCl, besonders bevorzugt für Sn(n-Bu)<sub>3</sub>, Sn(Me)<sub>3</sub>, Sn(Phenyl)<sub>3</sub> oder ZnBr, ganz besonders bevorzugt für Sn(n-Bu)<sub>3</sub>, Sn(Me)<sub>3</sub> oder ZnBr.

10

Pyridin-Verbindungen der Formel (V) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

15

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid. Besonders bevorzugt verwendet man aromatische Kohlenwasserstoffe, ganz besonders bevorzugt Benzol,  
20 Toluol oder Xylol.

25

30

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man im allgemeinen einen Palladium-Katalysator ein, der wiederum mit oder ohne Zusatz von weiteren Liganden verwendet werden kann. Vorzugsweise verwendet man als Katalysator PdCl<sub>2</sub>(dppf) [dppf = 1,1'-Bis(diphenylphosphino)ferrocene], Pd(PPh<sub>3</sub>)<sub>4</sub>, PdCl<sub>2</sub>(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>, PdCl<sub>2</sub>(CH<sub>3</sub>CN)<sub>2</sub>, Pd<sub>2</sub>(dba)<sub>3</sub> [dba = Dibenzylidenaceton] oder

$\text{Pd}(\text{OAc})_2$ , besonders bevorzugt  $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$ ,  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ ,  $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ , oder  $\text{Pd}(\text{OAc})_2$ , ganz besonders bevorzugt  $\text{PdCl}_2(\text{dppf})$  oder  $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ .

Als Liganden kommen Triarylphosphine, Trialkylphosphine oder Arsine in Frage.  
5 Vorzugsweise verwendet man  $\text{dppf}$ ,  $\text{PPh}_3$ ,  $\text{P}(\text{t-Bu})_3$ ,  $\text{Pcy}_3$  oder  $\text{AsPh}_3$ , besonders bevorzugt  $\text{dppf}$ .

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen  
10 arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^\circ\text{C}$  und  $200^\circ\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^\circ\text{C}$  und  $150^\circ\text{C}$ .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (B) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (IV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss  
15 an Verbindung der Formel (V), sowie 1-5 Mol% an Katalysator ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt und das Rohprodukt nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell vorhandenen  
20 Verunreinigungen befreit.

### Verfahren (C)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-c) allgemein definiert. In  
25 dieser Formel stehen  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ , X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.  $\text{E}^3$  steht bevorzugt für  
30  $-\text{OR}^{16}$ , wobei  $\text{R}^{16}$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen stehen, die bereits in Zusammenhang mit der



Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

5 Die Pyridylpyrimidine der Formel (I-c) fallen unter die Definition der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und werden nach einem der Verfahren (A) oder (B) hergestellt.

10 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Zwischenprodukte entstehenden Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-d) allgemein definiert. In dieser Formel stehen  $R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VI) allgemein definiert. In dieser Formel stehen  $R^{17}$  und  $R^{18}$  bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders  
20 bevorzugt etc. genannt wurden.

Amine der Formel (VI) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

25 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonnitril; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alko-  
30 hole, ganz besonders bevorzugt Methanol oder Ethanol.

Als wasserabsorbierendes Reagenz kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils alle üblichen Dehydratisierungsreagenzien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Carbodiimide. Besonders bevorzugt verwendet man Dicyclohexylcarbodiimid (DCC) oder N-(3-Dimethylaminopropyl)-N'-ethyl-carbo-  
5 diimid (EDC).

Als Base kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natrium-  
10 hydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $200^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  
15  $0^{\circ}\text{C}$  und  $150^{\circ}\text{C}$ , ganz besonders bevorzugt zwischen  $20^{\circ}\text{C}$  und  $100^{\circ}\text{C}$ .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (C) wird im allgemeinen 1 Mol an Verbindung der Formel (I-c) in der ersten Stufe zunächst mit einer Base behandelt und in der zweiten Stufe mit 1 Mol oder einem leichten Überschuss an  
20 Verbindung der Formel (VI), sowie 1-1.5 Mol% an wasserabsorbierendem Reagenz versetzt. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt und das Rohprodukt nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisa-  
25 tion, von eventuell vorhandenen Verunreinigungen befreit.

#### Verfahren (D)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-f) allgemein definiert. In  
30 dieser Formel stehen  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ , X, n, Z und R bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang

mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

5 Die Pyridylpyrimidine der Formel (I-f) fallen unter die Definition der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) und werden zum Beispiel nach einem der Verfahren (A) oder (B) hergestellt.

10 Als Oxidationsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) kommen alle üblichen zur Schwefeloxidation verwendbaren Oxidationsmittel infrage. Insbesondere geeignet sind Wasserstoffperoxid, organische Persäuren, wie beispielsweise Peressigsäure, m-Chlorperbenzoesäure, p-Nitroperbenzoesäure oder Luft-  
sauerstoff.

15 Als Verdünnungsmittel zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) kommen ebenfalls inerte organische Lösungsmittel infrage. Vorzugsweise verwendet man Kohlenwasserstoffe, wie Benzin, Benzol, Toluol, Hexan oder Petrolether; chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, 1,2-Dichlorethan, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff oder Chlorbenzol; Ether, wie Diethylether, Dioxan oder Tetrahydrofuran; Carbonsäuren, wie Essigsäure oder Propionsäure; oder dipolare aprotische  
20 Lösungsmittel, wie Acetonitril, Aceton, Essigsäureethylester oder Dimethylformamid.

25 Das erfindungsgemäße Verfahren (D) kann gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels durchgeführt werden. Als solche kommen alle üblicherweise verwendbaren organischen und anorganischen Säurebindemittel infrage. Vorzugsweise verwendet man Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, -acetate oder -carbonate, wie beispielsweise Calciumhydroxid, Natriumhydroxid, Natriumacetat oder Natriumcarbonat.

30 Das erfindungsgemäße Verfahren (D) kann gegebenenfalls in Gegenwart eines geeigneten Katalysators durchgeführt werden. Als solche kommen alle üblicherweise für derartige Schwefeloxidationen gebräuchlichen Metallsalz-Katalysatoren infrage.

Beispielhaft genannt sei in diesem Zusammenhang Ammoniummolybdat und Natriumwolframat.

5 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $+70^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise bei Temperaturen zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $+50^{\circ}\text{C}$ .

10 Zur Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (D) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (I-f) im allgemeinen 0,8 bis 1,2 Mol, vorzugsweise äquimolare Mengen Oxidationsmittel ein, wenn man die Oxidation des Schwefels auf der Sulfoxidstufe unterbrechen will. Zur Oxidation zum Sulfon setzt man pro Mol an Verbindung der Formel (I-f) im allgemeinen 1,8 bis 3,0 Mol, vorzugsweise doppelt  
15 und Isolierung der Endprodukte erfolgt nach üblichen Verfahren.

#### Verfahren (E)

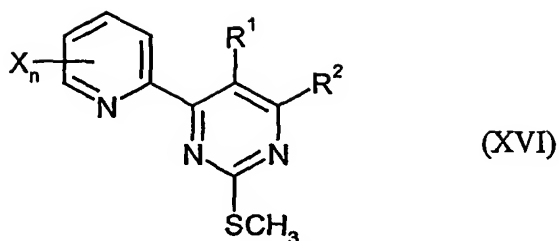
20 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine sind durch die Formel (VII) allgemein definiert. In dieser Formel stehen  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ , X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

25

Die Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

c) Methylthio-Derivate der Formel (XVI)

30



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit einem Oxidationsmittel (z.B. m-Chlorperbenzoesäure) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Dichlormethan) umgesetzt.

10

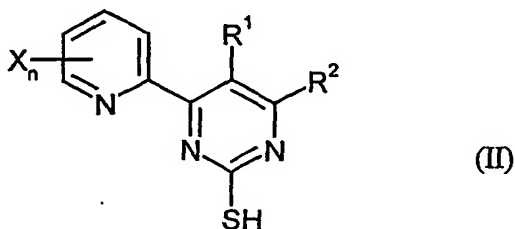
Die bei der Durchführung des Verfahrens (c) als Ausgangsstoffe benötigten Methylthio-Derivate sind durch die Formel (XVI) allgemein definiert. In dieser Formel steht  $R^1$ ,  $R^2$ , X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15

Methylthio-Derivate der Formel (XVI) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

d) Thiole der Formel (II)

20



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben

mit einem Methylierungsreagenz (z.B. Iodmethan) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Acetonitril) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Kaliumcarbonat) umgesetzt.

5

Thiole der Formel (II) wurden bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) beschrieben.

10

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) als Ausgangsstoffe benötigten Amine sind durch die Formel (VIII) allgemein definiert. In dieser Formel stehen Z und R<sup>9</sup> bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

15

Amine der Formel (VIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

20

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid, Tetrahydrofuran oder Dimethylsulfoxid.

30

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen

in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $200^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $150^{\circ}\text{C}$ , ganz besonders bevorzugt zwischen  $20^{\circ}\text{C}$  und  $100^{\circ}\text{C}$ .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (E) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (VIII), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

#### Verfahren (F)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (E) beschrieben.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxy-Verbindungen sind durch die Formel (IX) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid.

20

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, sowie tertiäre Amine, wie Trimethylamin, Triethylamin, Tributylamin, N,N-Dimethylanilin, Pyridin, N-Methylpiperidin, N,N-Dimethylaminopyridin, Diazabicyclooctan (DABCO), Diazabicyclononen (DBN) oder Diazabicycloundecen (DBU). Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallcarbonate oder -hydride, ganz besonders bevorzugt Kaliumcarbonat oder Natriumhydrid.

30



Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $200^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $150^{\circ}\text{C}$ , ganz besonders bevorzugt zwischen  $20^{\circ}\text{C}$  und  $100^{\circ}\text{C}$ .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (F) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (VII) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (IX), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

#### Verfahren (G)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridin-Derivate der Formeln (X) und (XI) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (A) beschrieben.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) als Ausgangsstoffe benötigten Amidine sind durch die Formel (XII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Amidine der Formel (XII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alko-

5 hole, ganz besonders bevorzugt Methanol oder Ethanol.

Als Basen kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) jeweils alle für derartige Reaktionen üblichen anorganischen und organischen Basen

10 in Betracht. Vorzugsweise verwendbar sind Erdalkali- oder Alkalimetallhydroxide, wie Natriumhydroxid, Calciumhydroxid, Kaliumhydroxid, oder auch Ammoniumhydroxid, Alkalimetallhydride, wie Natriumhydrid, Alkalimetallcarbonate, wie Natriumcarbonat, Kaliumcarbonat, Kaliumhydrogencarbonat, Natriumhydrogencarbonat, Alkali- oder Erdalkalimetallacetate wie Natriumacetat, Kaliumacetat, Calciumacetat, Alkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriummethanolat.

15 Besonders bevorzugt verwendet man Alkalimetallalkoholate, ganz besonders bevorzugt Natriummethanolat.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen

20 Verfahrens (G) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $200^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $150^{\circ}\text{C}$ , ganz besonders bevorzugt zwischen  $20^{\circ}\text{C}$  und  $100^{\circ}\text{C}$ .

Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (G) setzt man auf 1 Mol an

25 Verbindung der Formel (X) oder (XI) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (XII), sowie 0.1-5 Mol an Säurebindemittel ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegeben-

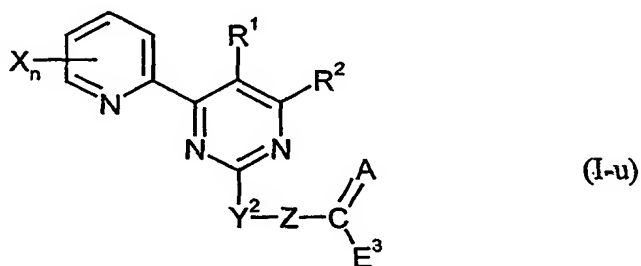
30 falls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (H)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-k) allgemein definiert. In dieser Formel stehen  $R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und A bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.  $Y^2$  steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder  $NR^9$ .

Pyridylpyrimidine der Formel (I-k) sind ebenfalls erfindungsgemäße Verbindungen, die sich zum Beispiel herstellen lassen, indem man

e) Ester der Formel (I-u)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X, n,  $Y^2$ , A und  $E^3$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit einer Base (z.B. Natriumhydroxid) gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Methanol) behandelt.

Pyridylpyrimidine der Formel (I-u) sind ebenfalls Teil dieser Erfindung und können über Verfahren (A) oder (B) hergestellt werden.

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) als Ausgangsstoffe benötigten Hydroxide sind durch die Formel (XIII) allgemein definiert. In dieser Formel steht M bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Hydroxide der Formel (XIII) sind bekannt und/oder lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) jeweils alle üblichen protischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Wasser oder Alkohole, wie Methanol, Ethanol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril. Besonders bevorzugt verwendet man Wasser oder Alkohole.

Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen arbeitet man bei Temperaturen zwischen 0°C und 200°C, vorzugsweise zwischen 0°C und 150°C, ganz besonders bevorzugt zwischen 20°C und 100°C.

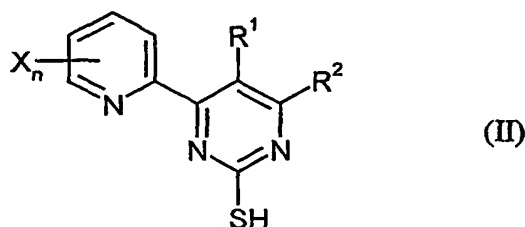
Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (H) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (I-k) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Verbindung der Formel (XIII) ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

Verfahren (J)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) als Ausgangsstoffe benötigten Nitrile sind durch die Formel (XIV) allgemein definiert. In dieser Formel  
 5 stehen  $R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Y und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

10 Nitrile der Formel (XIV) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

f) Thiole der Formel (II)



15 in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit chlorierten Nitrilen der Formel (XVII)

20



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Toluol) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Natriumhydroxid) umgesetzt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen der Formel (II) wurden bereits bei der Beschreibung des erfindungsgemäßen Verfahrens (A) beschrieben.

- 5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (f) als Ausgangsstoffe benötigten chlorierten Nitrile sind durch die Formel (XVII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt  
10 etc. genannt wurden.

Chlorierte Nitrile der Formel (XVII) sind bekannt.

- 15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) benötigten Trialkylzinnazide sind bekannt. Bevorzugt verwendet man Trimethylzinnazid oder Tri(n-butyl)zinnazid.

- Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugs-  
20 weise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether,  
25 Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie  
30 Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Toluol.

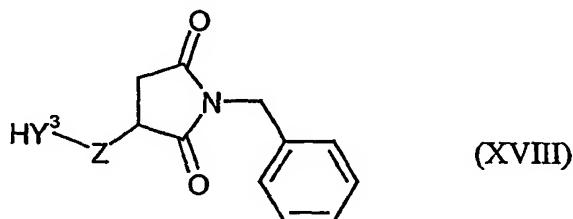
Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (J) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (XIV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss eines Trialkylzinnazids ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und einengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

#### Verfahren (K)

Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) als Ausgangsstoffe benötigten Pyridylpyrimidine sind durch die Formel (I-n) allgemein definiert. In dieser Formel stehen  $R^1$ ,  $R^2$ , X, n und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.  $Y^2$  steht bevorzugt für eine direkte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder  $NR^9$ .

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

g) Verbindungen der Formel (XVIII)



in welcher

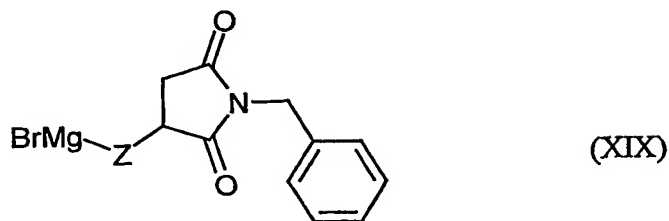
Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

$Y^3$  für Sauerstoff, Schwefel oder  $-NR^9$ - steht, wobei  $R^9$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

oder

5

Grignard-Verbindungen der Formel (XIX)

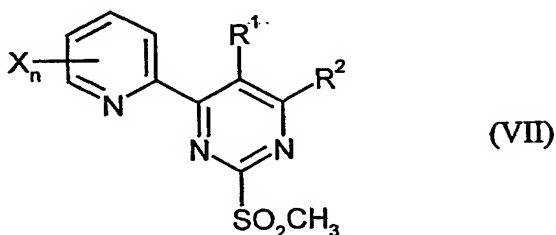


in welcher

10

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

mit Methylsulfonylpyrimidinen der Formel (VII)



15

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umgesetzt.



Die bei der Durchführung des Verfahrens (g) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formeln (XVIII) und (XIX) allgemein definiert. In diesen Formeln steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der  
5 erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

Verbindungen der Formel (XVIII) und Grignard-Verbindungen der Formel (XIX) lassen sich nach bekannten Verfahren herstellen.

10 Verbindungen der Formel (VII) wurden bereits oben im Zusammenhang mit der Beschreibung des Verfahrens (E) beschrieben.

Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether,  
15 Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester; Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone, wie Sulfolan. Besonders bevorzugt verwendet man Nitrile, Amide oder Sulfoxide, ganz besonders bevorzugt Acetonitril, Dimethylformamid, Tetrahydrofuran oder Dimethylsulfoxid.

25 Als Katalysator setzt man bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) alle für eine Hydrierungsreaktion üblichen Katalysatoren ein. Vorzugsweise verwendbar sind Palladium- oder Platin-Katalysatoren, besonders bevorzugt Palladium/Aktivkohle.

30 Die Reaktionstemperaturen können bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) jeweils in einem größeren Bereich variiert werden. Im allgemeinen

arbeitet man bei Temperaturen zwischen  $-20^{\circ}\text{C}$  und  $200^{\circ}\text{C}$ , vorzugsweise zwischen  $0^{\circ}\text{C}$  und  $150^{\circ}\text{C}$ .

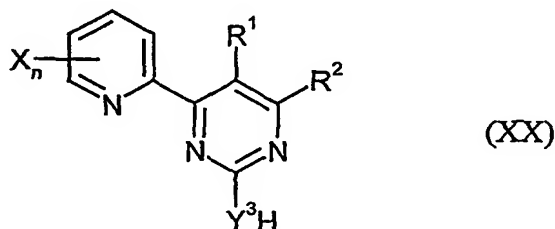
Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (K) setzt man auf 1 Mol an  
5 Verbindung der Formel (I-n) im allgemeinen 1-10 Mol% eines Katalysators ein. Es  
ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzu-  
setzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen verfährt  
man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische  
Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingeengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls  
10 nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell  
noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

#### Verfahren (L)

15 Die bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) als Ausgangsstoffe  
benötigten Keto-Verbindungen sind durch die Formel (XV) allgemein definiert. In  
dieser Formel stehen  $R^1$ ,  $R^2$ , X, n und Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz  
besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit  
der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als  
20 bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.  $Y^2$  steht bevorzugt für eine di-  
rekte Bindung, Schwefel, Sauerstoff oder  $\text{NR}^9$ .

Keto-Verbindungen der Formel (XV) sind neu. Sie lassen sich herstellen, indem man

25 h) Verbindungen der Formel (XX)

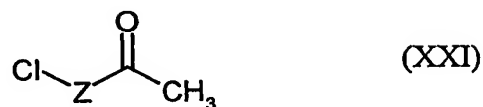


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X, n und  $Y^3$  die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Methylketonen der Formel (XXI)

5



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

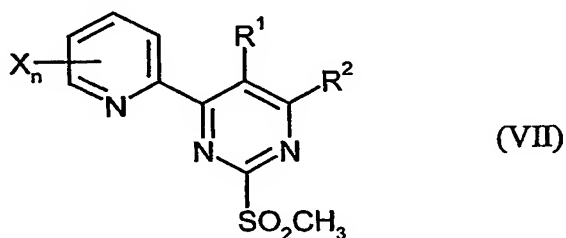
10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umgesetzt,

oder

15

i) Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

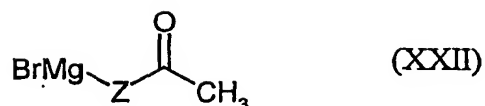


in welcher

20

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die oben angegebenen Bedeutungen haben,

mit Grignard-Verbindungen der Formel (XXII)



in welcher

Z die oben angegebenen Bedeutungen hat,

5

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels (z.B. Tetrahydrofuran) und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels (z.B. Triethylamin) umgesetzt.

10

Die bei der Durchführung des Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Verbindungen sind durch die Formel (XX) allgemein definiert. In dieser Formel stehen  $\text{R}^1$ ,  $\text{R}^2$ , X und n bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.  $\text{Y}^3$  steht bevorzugt für Schwefel, Sauerstoff oder  $\text{NR}^9$ .

15

Die Verbindungen der Formel (XX) sind teilweise bekannt und/oder lassen sich nach bekannte Verfahren herstellen.

20

Die bei der Durchführung des Verfahrens (h) als Ausgangsstoffe benötigten Methylketone sind durch die Formel (XXI) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.

25

Methylketone der Formel (XXI) sind bekannt.

Die bei der Durchführung des Verfahrens (i) als Ausgangsstoffe benötigten Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII) wurden bereits bei der Durchführung des Verfahrens (E) beschrieben.

- 5 Die bei der Durchführung des Verfahrens (i) als Ausgangsstoffe benötigten Grignard-Verbindungen sind durch die Formel (XXII) allgemein definiert. In dieser Formel steht Z bevorzugt, besonders bevorzugt bzw. ganz besonders bevorzugt für diejenigen Bedeutungen, die bereits in Zusammenhang mit der Beschreibung der erfindungsgemäßen Stoffe der Formel (I) für diese Reste als bevorzugt, besonders bevorzugt etc. genannt wurden.
- 10

Grignard-Verbindungen der Formel (XXII) sind bekannt.

- 15 Als Verdünnungsmittel kommen bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) jeweils alle üblichen inerten, organischen Solventien in Frage. Vorzugsweise verwendbar sind gegebenenfalls halogenierte aliphatische, alicyclische oder aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Petrolether, Hexan, Heptan, Cyclohexan, Methylcyclohexan, Benzol, Toluol, Xylol oder Decalin; Chlorbenzol, Dichlorbenzol, Dichlormethan, Chloroform, Tetrachlormethan, Dichlorethan oder Trichlorethan;
- 20 Ether, wie Diethylether, Diisopropylether, Methyl-t-butylether, Methyl-t-amylether, Dioxan, Tetrahydrofuran, 1,2-Dimethoxyethan, 1,2-Diethoxyethan oder Anisol; Nitrile, wie Acetonitril, Propionitril, n- oder i-Butyronitril oder Benzonitril; Amide, wie N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N-Methylformanilid, N-Methylpyrrolidon oder Hexamethylphosphorsäuretriamid; Ester wie Essigsäuremethylester oder Essigsäureethylester, Sulfoxide, wie Dimethylsulfoxid oder Sulfone,
- 25 wie Sulfolan.

- Bei der Durchführung des erfindungsgemäßen Verfahrens (L) setzt man auf 1 Mol an Verbindung der Formel (XV) im allgemeinen 1 Mol oder einen leichten Überschuss
- 30 an Ammoniumcarbonat und 1 Mol oder einen leichten Überschuss an Kaliumcyanid ein. Es ist jedoch auch möglich, die Reaktionskomponenten in anderen Verhältnissen einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt nach üblichen Methoden. Im allgemeinen ver-

führt man in der Weise, dass man das Reaktionsgemisch einengt, extrahiert, die organische Phase wäscht, trocknet, filtriert und eingengt. Der Rückstand wird gegebenenfalls nach üblichen Methoden, wie Chromatographie oder Umkristallisation, von eventuell noch vorhandenen Verunreinigungen befreit.

5

Bei der Durchführung aller erfindungsgemäßen Verfahren arbeitet man im allgemeinen unter Atmosphärendruck. Es ist aber auch möglich, jeweils unter erhöhtem oder vermindertem Druck zu arbeiten.

- 10 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich bei guter Pflanzenverträglichkeit und günstiger Warmblüttoxizität zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere Insekten, Spinnentieren und Nematoden, die in der Landwirtschaft, in Forsten, im Vorrats- und Materialschutz sowie auf dem Hygienesektor vorkommen. Sie können vorzugsweise als Pflanzenschutzmittel eingesetzt werden. Sie sind gegen  
15 normal sensible und resistente Arten sowie gegen alle oder einzelne Entwicklungsstadien wirksam. Zu den oben erwähnten Schädlingen gehören:

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Armadillidium vulgare*, *Porcellio scaber*.

20

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*.

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus carpophagus*, *Scutigera* spp.

Aus der Ordnung der Symphyla z.B. *Scutigera* spp.

Aus der Ordnung der Thysanura z.B. *Lepisma saccharina*.

Aus der Ordnung der Collembola z.B. *Onychiurus armatus*.

25

Aus der Ordnung der Orthoptera z.B. *Acheta domesticus*, *Gryllotalpa* spp., *Locusta migratoria migratorioides*, *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Leucophaea maderae*, *Blattella germanica*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

30

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Reticulitermes* spp..

Aus der Ordnung der Phthiraptera z.B. *Pediculus humanus corporis*, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Trichodectes* spp., *Damalinea* spp..

Aus der Ordnung der Thysanoptera z.B. *Hercinothrips femoralis*, *Thrips tabaci*, *Thrips palmi*, *Frankliniella accidentalis*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Eurygaster* spp., *Dysdercus intermedius*, *Piesma quadrata*, *Cimex lectularius*, *Rhodnius prolixus*, *Triatoma* spp.

5

Aus der Ordnung der Homoptera z.B. *Aleurodes brassicae*, *Bemisia tabaci*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Aphis gossypii*, *Brevicoryne brassicae*, *Cryptomyzus ribis*, *Aphis fabae*, *Aphis pomi*, *Eriosoma lanigerum*, *Hyalopterus arundinis*, *Phylloxera vastatrix*, *Pemphigus* spp., *Macrosiphum avenae*, *Myzus* spp., *Phorodon humuli*,  
10 *Rhopalosiphum padi*, *Empoasca* spp., *Euscelis bilobatus*, *Nephotettix cincticeps*, *Lecanium corni*, *Saissetia oleae*, *Laodelphax striatellus*, *Nilaparvata lugens*, *Aonidiella aurantii*, *Aspidiotus hederae*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp.

Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Pectinophora gossypiella*, *Bupalus piniarius*,  
15 *Cheimatobia brumata*, *Lithocolletis blancardella*, *Hyponomeuta padella*, *Plutella xylostella*, *Malacosoma neustria*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Lymantria* spp., *Bucculatrix thurberiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Agrotis* spp., *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Earias insulana*, *Heliothis* spp., *Mamestra brassicae*, *Panolis flammea*, *Spodoptera* spp., *Trichoplusia ni*, *Carpocapsa pomonella*, *Pieris* spp., *Chilo* spp., *Pyrausta nubilalis*,  
20 *Ephestia kuehniella*, *Galleria mellonella*, *Tineola bisselliella*, *Tinea pellionella*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Homona magnanima*, *Tortrix viridana*, *Cnaphalocerus* spp., *Oulema oryzae*.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anobium punctatum*, *Rhizopertha dominica*,  
25 *Bruchidius obtectus*, *Acanthoscelides obtectus*, *Hylotrupes bajulus*, *Agelastica alni*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Phaedon cochleariae*, *Diabrotica* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Epilachna varivestis*, *Atomaria* spp., *Oryzaephilus surinamensis*, *Anthonomus* spp., *Sitophilus* spp., *Otiorrhynchus sulcatus*, *Cosmopolites sordidus*,  
30 *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Hypera postica*, *Dermestes* spp., *Trogoderma* spp., *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Ptinus* spp., *Niptus hololeucus*, *Gibbium psylloides*, *Tribolium* spp., *Tenebrio molitor*, *Agriotes* spp.,

Conoderus spp., Melolontha melolontha, Amphimallon solstitialis, Costelytra zealandica, Lissorhoptrus oryzophilus.

5 Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

10 Aus der Ordnung der Diptera z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Drosophila melanogaster, Musca spp., Fannia spp., Calliphora erythrocephala, Lucilia spp., Chrysomyia spp., Cuterebra spp., Gastrophilus spp., Hyppobosca spp., Stomoxys spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Tabanus spp., Tannia spp., Bibio hortulanus, Oscinella frit, Phorbia spp., Pegomyia hyoscyami, Ceratitis capitata, Dacus oleae, Tipula paludosa, Hylemyia spp., Liriomyza spp..

15 Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. Xenopsylla cheopis, Ceratophyllus spp..

20 Aus der Klasse der Arachnida z.B. Scorpio maurus, Latrodectus mactans, Acarus siro, Argas spp., Ornithodoros spp., Dermanyssus gallinae, Eriophyes ribis, Phyllocoptura oleivora, Boophilus spp., Rhipicephalus spp., Amblyomma spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Sarcoptes spp., Tarsonemus spp., Bryobia praetiosa, Panonychus spp., Tetranychus spp., Hemitarsonemus spp., Brevipalpus spp..

25 Zu den pflanzenparasitären Nematoden gehören z.B. Pratylenchus spp., Radopholus similis, Ditylenchus dipsaci, Tylenchulus semipenetrans, Heterodera spp., Globodera spp., Meloidogyne spp., Aphelenchoides spp., Longidorus spp., Xiphinema spp., Trichodorus spp., Bursaphelenchus spp..

30 Die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel (I) zeichnen sich insbesondere durch eine hervorragende Wirkung gegen Raupen, Käferlarven, Spinnmilben, Blattläuse und Minierfliegen aus.



Die erfindungsgemäßen Verbindungen können gegebenenfalls in bestimmten Konzentrationen bzw. Aufwandmengen auch als Herbizide und Mikrobizide, beispielsweise als Fungizide, Antimykotika und Bakterizide verwendet werden. Sie lassen sich gegebenenfalls auch als Zwischen- oder Vorprodukte für die Synthese weiterer Wirkstoffe einsetzen.

Erfindungsgemäß können alle Pflanzen und Pflanzenteile behandelt werden. Unter Pflanzen werden hierbei alle Pflanzen und Pflanzenpopulationen verstanden, wie erwünschte und unerwünschte Wildpflanzen oder Kulturpflanzen (einschließlich natürlich vorkommender Kulturpflanzen). Kulturpflanzen können Pflanzen sein, die durch konventionelle Züchtungs- und Optimierungsmethoden oder durch biotechnologische und gentechnologische Methoden oder Kombinationen dieser Methoden erhalten werden können, einschließlich der transgenen Pflanzen und einschließlich der durch Sortenschutzrechte schützbaren oder nicht schützbaren Pflanzensorten. Unter Pflanzenteilen sollen alle oberirdischen und unterirdischen Teile und Organe der Pflanzen, wie Sproß, Blatt, Blüte und Wurzel verstanden werden, wobei beispielhaft Blätter, Nadeln, Stengel, Stämme, Blüten, Fruchtkörper, Früchte und Samen sowie Wurzeln, Knollen und Rhizome aufgeführt werden. Zu den Pflanzenteilen gehört auch Erntegut sowie vegetatives und generatives Vermehrungsmaterial, beispielsweise Stecklinge, Knollen, Rhizome, Ableger und Samen.

Die erfindungsgemäße Behandlung der Pflanzen und Pflanzenteile mit den Wirkstoffen erfolgt direkt oder durch Einwirkung auf deren Umgebung, Lebensraum oder Lagerraum nach den üblichen Behandlungsmethoden, z.B. durch Tauchen, Sprühen, Verdampfen, Vernebeln, Streuen, Aufstreichen und bei Vermehrungsmaterial, insbesondere bei Samen, weiterhin durch ein- oder mehrschichtiges Umhüllen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in die üblichen Formulierungen überführt werden, wie Lösungen, Emulsionen, Spritzpulver, Suspensionen, Pulver, Stäubemittel, Pasten, lösliche Pulver, Granulate, Suspensions-Emulsions-Konzentrate, Wirkstoff-imprägnierte Natur- und synthetische Stoffe sowie Feinstverkapselungen in polymeren Stoffen.

Diese Formulierungen werden in bekannter Weise hergestellt, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit Streckmitteln, also flüssigen Lösungsmitteln und/oder festen Trägerstoffen, gegebenenfalls unter Verwendung von oberflächenaktiven Mitteln, also Emulgiermitteln und/oder Dispergiermitteln und/oder schaum-  
5 erzeugenden Mitteln.

Im Falle der Benutzung von Wasser als Streckmittel können z.B. auch organische Lösungsmittel als Hilfslösungsmittel verwendet werden. Als flüssige Lösungsmittel kommen im wesentlichen in Frage: Aromaten, wie Xylol, Toluol, oder Alkylnaphthaline, chlorierte Aromaten und chlorierte aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie  
10 Chlorbenzole, Chlorethylene oder Methylenchlorid, aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie Cyclohexan oder Paraffine, z.B. Erdölfraktionen, mineralische und pflanzliche Öle, Alkohole, wie Butanol oder Glykol sowie deren Ether und Ester, Ketone wie Aceton, Methylethylketon, Methylisobutylketon oder Cyclohexanon, stark polare  
15 Lösungsmittel, wie Dimethylformamid und Dimethylsulfoxid, sowie Wasser.

Als feste Trägerstoffe kommen in Frage:

z.B. Ammoniumsalze und natürliche Gesteinsmehle, wie Kaoline, Tonerden, Talkum, Kreide, Quarz, Attapulgit, Montmorillonit oder Diatomeenerde und synthetische Gesteinsmehle, wie hochdisperse Kieselsäure, Aluminiumoxid und Silikate, als feste Trägerstoffe für Granulate kommen in Frage: z.B. gebrochene und fraktionierte natürliche Gesteine wie Calcit, Marmor, Bims, Sepiolith, Dolomit sowie synthetische Granulate aus anorganischen und organischen Mehlen sowie Granulate aus  
20 organischem Material wie Sägemehl, Kokosnußschalen, Maiskolben und Tabakstengeln;

als Emulgier- und/oder schaumerzeugende Mittel kommen in Frage: z.B. nichtionogene und anionische Emulgatoren, wie Polyoxyethylen-Fettsäure-Ester, Polyoxyethylen-Fettalkohol-Ether, z.B. Alkylaryl-polyglykolether, Alkylsulfonate, Alkylsulfate, Arylsulfonate sowie Einweißhydrolysate;

30

als Dispergiermittel kommen in Frage: z.B. Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose.

5 Es können in den Formulierungen Haftmittel wie Carboxymethylcellulose, natürliche und synthetische pulvrige, körnige oder latexförmige Polymere verwendet werden, wie Gummiarabicum, Polyvinylalkohol, Polyvinylacetat, sowie natürliche Phospholipide, wie Kepheline und Lecithine und synthetische Phospholipide. Weitere Additive können mineralische und vegetabile Öle sein.

10 Es können Farbstoffe wie anorganische Pigmente, z.B. Eisenoxid, Titanoxid, Ferrocyanblau und organische Farbstoffe, wie Alizarin-, Azo- und Metallphthalocyanin-farbstoffe und Spurennährstoffe wie Salze von Eisen, Mangan, Bor, Kupfer, Kobalt, Molybdän und Zink verwendet werden.

15 Die Formulierungen enthalten im allgemeinen zwischen 0,1 und 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 %.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können in handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung  
20 mit anderen Wirkstoffen, wie Insektiziden, Lockstoffen, Sterilantien, Bakteriziden, Akariziden, Nematiziden, Fungiziden, wachstumsregulierenden Stoffen oder Herbiziden vorliegen. Zu den Insektiziden zählen beispielsweise Phosphorsäureester, Carbamate, Carbonsäureester, chlorierte Kohlenwasserstoffe, Phenylharnstoffe, durch Mikroorganismen hergestellte Stoffe u.a.

25

Besonders günstige Mischpartner sind z.B. die folgenden:

**Fungizide:**

30 Aldimorph, Ampropylfos, Ampropylfos-Kalium, Andoprim, Anilazin, Azaconazol, Azoxystrobin, Benalaxyl, Benodanil, Benomyl, Benzamacril, Benzamacryl-isobutyl, Bialaphos, Binapacryl, Biphenyl, Bitertanol, Blasticidin-S, Bromuconazol, Bupirimat, Buthiobat,

- Calciumpolysulfid, Capsimycin, Captafol, Captan, Carbendazim, Carboxin, Carvon, Chinomethionat (Quinomethionat), Chlobenthiazon, Chlorfenazol, Chloroneb, Chloropicrin, Chlorothalonil, Chlozolinat, Clozylacon, Cufraneb, Cymoxanil, Cyproconazol, Cyprodinil, Cyprofuram,
- 5 Debacarb, Dichlorophen, Diclobutrazol, Diclofluanid, Diclomezin, Dicloran, Diethofencarb, Difenconazol, Dimethirimol, Dimethomorph, Diniconazol, Diniconazol-M, Dinocap, Diphenylamin, Dipyrrithione, Ditalimfos, Dithianon, Dodemorph, Dodine, Drazoxolon,
- Ediphenphos, Epoxiconazol, Etaconazol, Ethirimol, Etridiazol,
- 10 Famoxadon, Fenapanil, Fenarimol, Fenbuconazol, Fenfuram, Fenitropan, Fencpiclonil, Fenpropidin, Fenpropimorph, Fentinacetat, Fentinhydroxyd, Ferbam, Ferimzon, Fluzinam, Flumetover, Fluoromid, Fluquinconazol, Flurprimidol, Flusilazol, Flusulfamid, Flutolanil, Flutriafol, Folpet, Fosetyl-Aluminium, Fosetyl-Natrium, Fthalid, Fuberidazol, Furalaxyl, Furametpyr, Furcarbonil, Furconazol, Furconazol-cis, Fumecyclox, Guazatin,
- 15 Hexachlorobenzol, Hexaconazol, Hymexazol, Imazalil, Imibenconazol, Iminoctadin, Iminoctadinealbesilat, Iminoctadinetriacetat, Iodocarb, Ipconazol, Iprobenfos (IBP), Iprodione, Irumamycin, Isoprothiolan, Isovaldione,
- Kasugamycin, Kresoxim-methyl, Kupfer-Zubereitungen, wie: Kupferhydroxid,
- 20 Kupfernaphthenat, Kupferoxychlorid, Kupfersulfat, Kupferoxid, Oxin-Kupfer und Bordeaux-Mischung,
- Mancopper, Mancozeb, Maneb, Meferimzone, Mepanipyrim, Mepronil, Metalaxyl, Metconazol, Methasulfocarb, Methfuroxam, Metiram, Metomeclam, Metsulfovax, Mildiomyacin, Myclobutanil, Myclozolin,
- 25 Nickel-dimethyldithiocarbamat, Nitrothal-isopropyl, Nuarimol, Ofurace, Oxadixyl, Oxamocarb, Oxolinicacid, Oxycarboxim, Oxyfenthiin, Paclobutrazol, Pefurazoat, Penconazol, Pencycuron, Phosdiphen, Pimaricin, Piperalin, Polyoxin, Polyoxorim, Probenazol, Prochloraz, Procymidon, Propamocarb, Propanosine-Natrium, Propiconazol, Propineb, Pyrazophos, Pyrifenox, Pyrimethanil, Pyroquilon,
- 30 Pyroxyfur, Quinconazol, Quintozen (PCNB), Schwefel und Schwefel-Zubereitungen,

- Tebuconazol, Tecloftalam, Tecnazen, Tetcyclacis, Tetraconazol, Thiabendazol, Thicy-  
 ofen, Thifluzamide, Thiophanate-methyl, Thiram, Tioxymid, Tolclofos-methyl,  
 Tolyfluanid, Triadimefon, Triadimenol, Triazbutil, Triazoxid, Trichlamid, Tricyclazol,  
 Tridemorph, Triflumizol, Triforin, Triticonazol,
- 5 Uniconazol,  
 Validamycin A, Vinclozolin, Viniconazol,  
 Zarilamid, Zineb, Ziram sowie  
 Dagger G, OK-8705, OK-8801,  
 $\alpha$ -(1,1-Dimethylethyl)- $\beta$ -(2-phenoxyethyl)-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 10  $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -fluor- $\beta$ -propyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 $\alpha$ -(2,4-Dichlorphenyl)- $\beta$ -methoxy- $\alpha$ -methyl-1H-1,2,4-triazol-1-ethanol,  
 $\alpha$ -(5-Methyl-1,3-dioxan-5-yl)- $\beta$ -[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methylen]-1H-1,2,4-tria-  
 zol-1-ethanol,  
 (5RS,6RS)-6-Hydroxy-2,2,7,7-tetramethyl-5-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-3-octanon,  
 15 (E)- $\alpha$ -(Methoxyimino)-N-methyl-2-phenoxy-phenylacetamid,  
 {2-Methyl-1-[[[1-(4-methylphenyl)-ethyl]-amino]-carbonyl]-propyl}-carbaminsäure-1-  
 isopropylester  
 1-(2,4-Dichlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-ethanon-O-(phenylmethyl)-oxim,  
 1-(2-Methyl-1-naphthalenyl)-1H-pyrrol-2,5-dion,  
 20 1-(3,5-Dichlorphenyl)-3-(2-propenyl)-2,5-pyrrolidindion,  
 1-[(Diiodmethyl)-sulfonyl]-4-methyl-benzol,  
 1-[[2-(2,4-Dichlorphenyl)-1,3-dioxolan-2-yl]-methyl]-1H-imidazol,  
 1-[[2-(4-Chlorphenyl)-3-phenyloxiranyl]-methyl]-1H-1,2,4-triazol,  
 1-[1-[2-[(2,4-Dichlorphenyl)-methoxy]-phenyl]-ethenyl]-1H-imidazol,  
 25 1-Methyl-5-nonyl-2-(phenylmethyl)-3-pyrrolidinol,  
 2',6'-Dibrom-2-methyl-4'-trifluormethoxy-4'-trifluor-methyl-1,3-thiazol-5-carboxanilid,  
 2,2-Dichlor-N-[1-(4-chlorphenyl)-ethyl]-1-ethyl-3-methyl-cyclopropancarboxamid,  
 2,6-Dichlor-5-(methylthio)-4-pyrimidinyl-thiocyanat,  
 2,6-Dichlor-N-(4-trifluormethylbenzyl)-benzamid,  
 30 2,6-Dichlor-N-[[4-(trifluormethyl)-phenyl]-methyl]-benzamid,  
 2-(2,3,3-Triiod-2-propenyl)-2H-tetrazol,  
 2-[(1-Methylethyl)-sulfonyl]-5-(trichlormethyl)-1,3,4-thiadiazol,

- 2-[[6-Deoxy-4-O-(4-O-methyl- $\beta$ -D-glycopyranosyl)- $\alpha$ -D-glucopyranosyl]-amino]-4-methoxy-1H-pyrrolo[2,3-d]pyrimidin-5-carbonitril,  
 2-Aminobutan,  
 2-Brom-2-(brommethyl)-pentandinitril,  
 5 2-Chlor-N-(2,3-dihydro-1,1,3-trimethyl-1H-inden-4-yl)-3-pyridincarboxamid,  
 2-Chlor-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(isothiocyanatomethyl)-acetamid,  
 2-Phenylphenol(OPP),  
 3,4-Dichlor-1-[4-(difluormethoxy)-phenyl]-1H-pyrrol-2,5-dion,  
 3,5-Dichlor-N-[cyan[(1-methyl-2-propynyl)-oxy]-methyl]-benzamid,  
 10 3-(1,1-Dimethylpropyl-1-oxo-1H-inden-2-carbonitril,  
 3-[2-(4-Chlorphenyl)-5-ethoxy-3-isoxazolidinyl]-pyridin,  
 4-Chlor-2-cyan-N,N-dimethyl-5-(4-methylphenyl)-1H-imidazol-1-sulfonamid,  
 4-Methyl-tetrazolo[1,5-a]quinazolin-5(4H)-on,  
 8-(1,1-Dimethylethyl)-N-ethyl-N-propyl-1,4-dioxaspiro[4.5]decan-2-methanamin,  
 15 8-Hydroxychinolinsulfat,  
 9H-Xanthen-9-carbonsäure-2-[(phenylamino)-carbonyl]-hydrazid,  
 bis-(1-Methylethyl)-3-methyl-4-[(3-methylbenzoyl)-oxy]-2,5-thiophendicarboxylat,  
 cis-1-(4-Chlorphenyl)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-yl)-cycloheptanol,  
 cis-4-[3-[4-(1,1-Dimethylpropyl)-phenyl-2-methylpropyl]-2,6-dimethyl-morpholin-  
 20 hydrochlorid,  
 Ethyl-[(4-chlorphenyl)-azo]-cyanoacetat,  
 Kaliumhydrogencarbonat,  
 Methantetrathiol-Natriumsalz,  
 Methyl-1-(2,3-dihydro-2,2-dimethyl-1H-inden-1-yl)-1H-imidazol-5-carboxylat,  
 25 Methyl-N-(2,6-dimethylphenyl)-N-(5-isoxazolylcarbonyl)-DL-alaninat,  
 Methyl-N-(chloracetyl)-N-(2,6-dimethylphenyl)-DL-alaninat,  
 N-(2,3-Dichlor-4-hydroxyphenyl)-1-methyl-cyclohexancarboxamid.  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-furanyl)-acetamid,  
 N-(2,6-Dimethylphenyl)-2-methoxy-N-(tetrahydro-2-oxo-3-thienyl)-acetamid,  
 30 N-(2-Chlor-4-nitrophenyl)-4-methyl-3-nitro-benzolsulfonamid,  
 N-(4-Cyclohexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,  
 N-(4-Hexylphenyl)-1,4,5,6-tetrahydro-2-pyrimidinamin,

- N-(5-Chlor-2-methylphenyl)-2-methoxy-N-(2-oxo-3-oxazolidinyl)-acetamid,  
 N-(6-Methoxy)-3-pyridinyl)-cyclopropanecarboxamid,  
 N-[2,2,2-Trichlor-1-[(chloracetyl)-amino]-ethyl]-benzamid,  
 N-[3-Chlor-4,5-bis-(2-propinyloxy)-phenyl]-N'-methoxy-methanimidamid,  
 5 N-Formyl-N-hydroxy-DL-alanin -Natriumsalz,  
 O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat,  
 O-Methyl-S-phenyl-phenylpropylphosphoramidothioate,  
 S-Methyl-1,2,3-benzothiadiazol-7-carbothioat,  
 spiro[2H]-1-Benzopyran-2,1'(3'H)-isobenzofuran]-3'-on,

10

**Bakterizide:**

Bronopol, Dichlorophen, Nitrapyrin, Nickel-Dimethyldithiocarbamat, Kasugamycin,  
 Oethilnon, Furancarbonsäure, Oxytetracyclin, Probenazol, Streptomycin, Teclof-  
 talam, Kupfersulfat und andere Kupfer-Zubereitungen.

15

**Insektizide / Akarizide / Nematizide:**

- Abamectin, Acephate, Acetamiprid, Acrinathrin, Alanycarb, Aldicarb, Aldoxycarb,  
 Alpha-cypermethrin, Alphamethrin, Amitraz, Avermectin, AZ 60541, Azadirachtin,  
 Azamethiphos, Azinphos A, Azinphos M, Azocyclotin,
- 20 Bacillus popilliae, Bacillus sphaericus, Bacillus subtilis, Bacillus thuringiensis,  
 Baculoviren, Beauveria bassiana, Beauveria tenella, Bendiocarb, Benfuracarb,  
 Bensultap, Benzoximate, Betacyfluthrin, Bifenazate, Bifenthrin, Bioethanomethrin,  
 Biopermethrin, BPMC, Bromophos A, Bufencarb, Buprofezin, Butathiofos, Butocar-  
 boxim, Butylpyridaben,
- 25 Cadusafos, Carbaryl, Carbofuran, Carbophenothion, Carbosulfan, Cartap, Chloetho-  
 carb, Chlorethoxyfos, Chlorfenapyr, Chlorfenvinphos, Chlorfluazuron, Chlormephos,  
 Chlorpyrifos, Chlorpyrifos M, Chlovaporthrin, Cis-Resmethrin, Cispermethrin,  
 Clocythrin, Cloethocarb, Clofentezine, Cyanophos, Cycloprene, Cycloprothrin,  
 Cyfluthrin, Cyhalothrin, Cyhexatin, Cypermethrin, Cyromazine,
- 30 Deltamethrin, Demeton M, Demeton S, Demeton-S-methyl, Diafenthiuron, Diazinon,  
 Dichlorvos, Diflubenzuron, Dimethoat, Dimethylvinphos, Diofenolan, Disulfoton,  
 Docusat-sodium, Dofenapyn,

- Eflusilanate, Enamectin, Empenthrin, Endosulfan, Entomopffthora spp., Eprinomectin, Esfenvalerate, Ethiofencarb, Ethion, Ethoprophos, Etofenprox, Etoxazole, Etrimfos,
- 5 Fenamiphos, Fenazaquin, Fenbutatin oxide, Fenitrothion, Fenothiocarb, Fenoxacrim, Fenoxycarb, Fenpropathrin, Fenpyrad, Fenpyrithrin, Fenpyroximate, Fenvalerate, Fipronil, Fluazuron, Flubrocycrin, Flucycloxuron, Flucythrinate, Flufenoxuron, Flutenzine, Fluvalinate, Fonophos, Fosmethilan, Fosthiazate, Fubfenprox, Furathiocarb,
- Granuloseviren
- 10 Halofenozide, HCH, Heptenophos, Hexaflumuron, Hexythiazox, Hydroprene, Imidacloprid, Isazofos, Isofenphos, Isoxathion, Ivermectin, Kempolyederviren
- Lambda-cyhalothrin, Lufenuron
- 15 Malathion, Mecarbam, Metaldehyd, Methamidophos, Metharhizium anisopliae, Metharhizium flavoviride, Methidathion, Methiocarb, Methomyl, Methoxyfenozide, Metolcarb, Metoxadiazon, Mevinphos, Milbemectin, Monocrotophos, Naled, Nitenpyram, Nithiazine, Novaluron
- Omethoat, Oxamyl, Oxydemeton M
- Paecilomyces fumosoroseus, Parathion A, Parathion M, Permethrin, Phenthoat,
- 20 Phorat, Phosalone, Phosmet, Phosphamidon, Phoxim, Pirimicarb, Pirimiphos A, Pirimiphos M, Profenofos, Promecarb, Propoxur, Prothiofos, Prothoat, Pymetrozine, Pyraclofos, Pyresmethrin, Pyrethrum, Pyridaben, Pyridathion, Pyrimidifen, Pyriproxyfen,
- Quinalphos,
- 25 Ribavirin
- Salithion, Sebufos, Selamectin, Silafluofen, Spinosad, Sulfotep, Sulprofos, Tau-fluvalinate, Tebufenozide, Tebufenpyrad, Tebupirimiphos, Teflubenzuron, Tefluthrin, Temephos, Temiviphos, Terbufos, Tetrachlorvinphos, Theta-cypermethrin, Thiamethoxam, Thiapronil, Thiatrithos, Thiocyclam hydrogen oxalate,
- 30 Thiodicarb, Thiofanox, Thuringiensin, Tralocycrin, Tralomethrin, Triarathene, Triazamate, Triazophos, Triazuron, Trichlophenidine, Trichlorfon, Triflumuron, Trimethacarb,



Vamidothion, Vaniliprole, Verticillium lecanii

YI 5302

Zeta-cypermethrin, Zolaprofos

(1R-cis)-[5-(Phenylmethyl)-3-furanyl]-methyl-3-[(dihydro-2-oxo-3(2H)-furanylidene)-  
5 methyl]-2,2-dimethylcyclopropanecarboxylat

(3-Phenoxyphenyl)-methyl-2,2,3,3-tetramethylcyclopropanecarboxylat

1-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]tetrahydro-3,5-dimethyl-N-nitro-1,3,5-triazin-2(1H)-  
imin

2-(2-Chlor-6-fluorphenyl)-4-[4-(1,1-dimethylethyl)phenyl]-4,5-dihydro-oxazol

10 2-(Acetyloxy)-3-dodecyl-1,4-naphthalindion

2-Chlor-N-[[[4-(1-phenylethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

2-Chlor-N-[[[4-(2,2-dichlor-1,1-difluorethoxy)-phenyl]-amino]-carbonyl]-benzamid

3-Methylphenyl-propylcarbamat

4-[4-(4-Ethoxyphenyl)-4-methylpentyl]-1-fluor-2-phenoxy-benzol

15 4-Chlor-2-(1,1-dimethylethyl)-5-[[2-(2,6-dimethyl-4-phenoxyphenoxy)ethyl]thio]-  
3(2H)-pyridazinon

4-Chlor-2-(2-chlor-2-methylpropyl)-5-[(6-iod-3-pyridinyl)methoxy]-3(2H)-pyrida-  
zinon

4-Chlor-5-[(6-chlor-3-pyridinyl)methoxy]-2-(3,4-dichlorphenyl)-3(2H)-pyridazinon

20 Bacillus thuringiensis strain EG-2348

Benzoessäure [2-benzoyl-1-(1,1-dimethylethyl)-hydrazid

Butansäure 2,2-dimethyl-3-(2,4-dichlorphenyl)-2-oxo-1-oxaspiro[4.5]dec-3-en-4-yl-  
ester

[3-[(6-Chlor-3-pyridinyl)methyl]-2-thiazolidinyliden]-cyanamid

25 Dihydro-2-(nitromethylen)-2H-1,3-thiazine-3(4H)-carboxaldehyd

Ethyl-[2-[[1,6-dihydro-6-oxo-1-(phenylmethyl)-4-pyridazinyl]oxy]ethyl]-carbamat

N-(3,4,4-Trifluor-1-oxo-3-butenyl)-glycin

N-(4-Chlorphenyl)-3-[4-(difluormethoxy)phenyl]-4,5-dihydro-4-phenyl-1H-pyrazol-  
1-carboxamid

30 N-[(2-Chlor-5-thiazolyl)methyl]-N'-methyl-N''-nitro-guanidin

N-Methyl-N'-(1-methyl-2-propenyl)-1,2-hydrazindicarbothioamid

N-Methyl-N'-2-propenyl-1,2-hydrazindicarbothioamid

O,O-Diethyl-[2-(dipropylamino)-2-oxoethyl]-ethylphosphoramidothioat

Auch eine Mischung mit anderen bekannten Wirkstoffen, wie Herbiziden oder mit Düngemitteln und Wachstumsregulatoren ist möglich.

5

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können ferner beim Einsatz als Insektizide in ihren handelsüblichen Formulierungen sowie in den aus diesen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen in Mischung mit Synergisten vorliegen. Synergisten sind Verbindungen, durch die die Wirkung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe  
10 gesteigert wird, ohne dass der zugesetzte Synergist selbst aktiv wirksam sein muss.

Der Wirkstoffgehalt der aus den handelsüblichen Formulierungen bereiteten Anwendungsformen kann in weiten Bereichen variieren. Die Wirkstoffkonzentration der Anwendungsformen kann von 0,0000001 bis zu 95 Gew.-% Wirkstoff, vorzugsweise  
15 zwischen 0,0001 und 1 Gew.-% liegen.

Die Anwendung geschieht in einer den Anwendungsformen angepassten üblichen Weise.

20 Bei der Anwendung gegen Hygiene- und Vorratsschädlinge zeichnet sich der Wirkstoff durch eine hervorragende Residualwirkung auf Holz und Ton sowie durch eine gute Alkalistabilität auf gekalkten Unterlagen aus.

Wie bereits oben erwähnt, können erfindungsgemäß alle Pflanzen und deren Teile  
25 behandelt werden. In einer bevorzugten Ausführungsform werden wild vorkommende oder durch konventionelle biologische Zuchtmethoden, wie Kreuzung oder Protoplastenfusion erhaltenen Pflanzenarten und Pflanzensorten sowie deren Teile behandelt. In einer weiteren bevorzugten Ausführungsform werden transgene Pflanzen und Pflanzensorten, die durch gentechnologische Methoden gegebenenfalls  
30 in Kombination mit konventionellen Methoden erhalten wurden (Genetic Modified Organisms) und deren Teile behandelt. Der Begriff „Teile“ bzw. „Teile von Pflanzen“ oder „Pflanzenteile“ wurde oben erläutert.

Besonders bevorzugt werden erfindungsgemäß Pflanzen der jeweils handelsüblichen oder in Gebrauch befindlichen Pflanzensorten behandelt. Unter Pflanzensorten versteht man Pflanzen mit bestimmten Eigenschaften („Traits“), die sowohl durch konventionelle Züchtung, durch Mutagenese oder durch rekombinante DNA-Techniken erhalten worden sind. Dies können Sorten, Bio- und Genotypen sein.

Je nach Pflanzenarten bzw. Pflanzensorten, deren Standort und Wachstumsbedingungen (Böden, Klima, Vegetationsperiode, Ernährung) können durch die erfindungsgemäße Behandlung auch über additive („synergistische“) Effekte auftreten. So sind beispielsweise erniedrigte Aufwandmengen und/oder Erweiterungen des Wirkungsspektrums und/oder eine Verstärkung der Wirkung der erfindungsgemäß verwendbaren Stoffe und Mittel, besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte möglich, die über die eigentlich zu erwartenden Effekte hinausgehen.

Zu den bevorzugten erfindungsgemäß zu behandelnden transgenen (gentechnologisch erhaltenen) Pflanzen bzw. Pflanzensorten gehören alle Pflanzen, die durch die gentechnologische Modifikation genetisches Material erhielten, welches diesen Pflanzen besondere vorteilhafte wertvolle Eigenschaften („Traits“) verleiht. Beispiele für solche Eigenschaften sind besseres Pflanzenwachstum, erhöhte Toleranz gegenüber hohen oder niedrigen Temperaturen, erhöhte Toleranz gegen Trockenheit oder gegen Wasser- bzw. Bodensalzgehalt, erhöhte Blühleistung, erleichterte Ernte, Beschleunigung der Reife, höhere Ernteerträge, höhere Qualität und/oder höherer Ernährungswert der Ernteprodukte, höhere Lagerfähigkeit und/oder Bearbeitbarkeit der Ernteprodukte. Weitere und besonders hervorgehobene Beispiele für solche Eigenschaften sind eine erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen tierische und mikrobielle Schädlinge, wie gegenüber Insekten, Milben, pflanzenpathogenen Pilzen, Bakterien und/oder Viren sowie eine erhöhte Toleranz der Pflanzen gegen bestimmte

herbizide Wirkstoffe. Als Beispiele transgener Pflanzen werden die wichtigen Kulturpflanzen, wie Getreide (Weizen, Reis), Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle, Raps sowie Obstpflanzen (mit den Früchten Äpfel, Birnen, Zitrusfrüchten und Weintrauben) erwähnt, wobei Mais, Soja, Kartoffel, Baumwolle und Raps besonders hervorgehoben werden. Als Eigenschaften („Traits“) werden besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr der Pflanzen gegen Insekten durch in den Pflanzen entstehende Toxine, insbesondere solche, die durch das genetische Material aus *Bacillus thuringiensis* (z.B. durch die Gene CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb und CryIF sowie deren Kombinationen) in den Pflanzen erzeugt werden (im folgenden „Bt Pflanzen“). Als Eigenschaften („Traits“) werden auch besonders hervorgehoben die erhöhte Abwehr von Pflanzen gegen Pilze, Bakterien und Viren durch Systemische Akquirierte Resistenz (SAR), Systemin, Phytoalexine, Elicitoren sowie Resistenzgene und entsprechend exprimierte Proteine und Toxine. Als Eigenschaften („Traits“) werden weiterhin besonders hervorgehoben die erhöhte Toleranz der Pflanzen gegenüber bestimmten herbiziden Wirkstoffen, beispielsweise Imidazolinonen, Sulfonylharnstoffen, Glyphosate oder Phosphinotricin (z.B. „PAT“-Gen). Die jeweils die gewünschten Eigenschaften („Traits“) verleihenden Gene können auch in Kombinationen miteinander in den transgenen Pflanzen vorkommen. Als Beispiele für „Bt Pflanzen“ seien Maissorten, Baumwollsorten, Sojasorten und Kartoffelsorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen YIELD GARD® (z.B. Mais, Baumwolle, Soja), KnockOut® (z.B. Mais), StarLink® (z.B. Mais), Bollgard® (Baumwolle), Nucotr® (Baumwolle) und NewLeaf® (Kartoffel) vertrieben werden. Als Beispiele für Herbizid tolerante Pflanzen seien Maissorten, Baumwollsorten und Sojasorten genannt, die unter den Handelsbezeichnungen Roundup Ready® (Toleranz gegen Glyphosate z.B. Mais, Baumwolle, Soja), Liberty Link® (Toleranz gegen Phosphinotricin, z.B. Raps), IMI® (Toleranz gegen Imidazolinone) und STS® (Toleranz gegen Sulfonylharnstoffe z.B. Mais) vertrieben werden. Als Herbizid resistente (konventionell auf Herbizid-Toleranz gezüchtete) Pflanzen seien auch die unter der Bezeichnung Clearfield® vertriebenen Sorten (z.B. Mais) erwähnt. Selbstverständlich gelten diese Aussagen auch für in der Zukunft entwickelte bzw. zukünftig auf den Markt kommende Pflanzensorten mit diesen oder zukünftig entwickelten genetischen Eigenschaften („Traits“).

Die aufgeführten Pflanzen können besonders vorteilhaft erfindungsgemäß mit den Verbindungen der allgemeinen Formel (I) bzw. den erfindungsgemäßen Wirkstoffmischungen behandelt werden. Die bei den Wirkstoffen bzw. Mischungen oben angegebenen Vorzugsbereiche gelten auch für die Behandlung dieser Pflanzen.

5 Besonders hervorgehoben sei die Pflanzenbehandlung mit den im vorliegenden Text speziell aufgeführten Verbindungen bzw. Mischungen.

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe wirken nicht nur gegen Pflanzen-, Hygiene- und Vorratsschädlinge, sondern auch auf dem veterinärmedizinischen Sektor gegen tierische Parasiten (Ektoparasiten) wie Schildzecken, Lederzecken, Räude milben, Laufmilben, Fliegen (stechend und leckend), parasitierende Fliegenlarven, Läuse, Haarlinge, Federlinge und Flöhe. Zu diesen Parasiten gehören:

10

Aus der Ordnung der Anoplurida z.B. Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp..

15

Aus der Ordnung der Mallophagida und den Unterordnungen Amblycerina sowie Ischnocerina z.B. Trimenopon spp., Menopon spp., Trinoton spp., Bovicola spp., Werneckiella spp., Lepikentron spp., Damalina spp., Trichodectes spp., Felicola spp..

20

Aus der Ordnung Diptera und den Unterordnungen Nematocerina sowie Brachycerina z.B. Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp..

25

Aus der Ordnung der Siphonapterida z.B. Pulex spp., Ctenocephalides spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp..

30

Aus der Ordnung der Heteropterida z.B. Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp..

Aus der Ordnung der Blattarida z.B. Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp..

5

Aus der Unterklasse der Acaria (Acarida) und den Ordnungen der Meta- sowie Mesostigmata z.B. Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp..

10

Aus der Ordnung der Actinedida (Prostigmata) und Acaridida (Astigmata) z.B. Aca-rapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletia spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp..

15

20

Beispielsweise zeigen sie gute Wirksamkeit gegen die Entwicklungsstadien von Zecken, gegen Fliegen und gegen Flöhe.

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) eignen sich auch zur Bekämpfung von Arthropoden, die landwirtschaftliche Nutztiere, wie z.B. Rinder, Schafe, Ziegen, Pferde, Schweine, Esel, Kamele, Büffel, Kaninchen, Hühner, Puten, Enten, Gänse, Bienen, sonstige Haustiere wie z.B. Hunde, Katzen, Stubenvögel, Aquarienfische sowie sogenannte Versuchstiere, wie z.B. Hamster, Meerschweinchen, Ratten und Mäuse befallen. Durch die Bekämpfung dieser Arthropoden sollen Todesfälle und Leistungsminderungen (bei Fleisch, Milch, Wolle, Häuten, Eiern, Honig usw.) vermindert werden, so dass durch den Einsatz der erfindungsgemäßen Wirkstoffe eine wirtschaftlichere und einfachere Tierhaltung möglich ist.

30

Die Anwendung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe geschieht im Veterinärsektor in bekannter Weise durch enterale Verabreichung in Form von beispielsweise Tabletten, Kapseln, Tränken, Drenchen, Granulaten, Pasten, Boli, des feed-through-Verfahrens, von Zäpfchen, durch parenterale Verabreichung, wie zum Beispiel durch Injektionen  
5 (intramuskulär, subcutan, intravenös, intraperitoneal u.a.), Implantate, durch nasale Applikation, durch dermale Anwendung in Form beispielsweise des Tauchens oder Badens (Dippen), Sprühens (Spray), Aufgießens (Pour-on und Spot-on), des Waschens, des Einpuderns sowie mit Hilfe von wirkstoffhaltigen Formkörpern, wie Halsbändern, Ohrmarken, Schwanzmarken, Gliedmaßenbändern, Halftern, Markie-  
10 rungsvorrichtungen usw.

Bei der Anwendung für Vieh, Geflügel, Haustiere etc. kann man die erfindungsgemäßen Wirkstoffe der Formel (I) als Formulierungen (beispielsweise Pulver, Emulsionen, fließfähige Mittel), die die erfindungsgemäßen Wirkstoffe in einer  
15 Menge von 1 bis 80 Gew.-% enthalten, direkt oder nach 100 bis 10 000-facher Verdünnung anwenden oder sie als chemisches Bad verwenden.

Außerdem wurde gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen eine hohe insektizide Wirkung gegen Insekten zeigen, die technische Materialien zerstören.  
20

Beispielhaft und vorzugsweise - ohne jedoch zu limitieren - seien die folgenden Insekten genannt:

Käfer wie  
25 *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.*  
30 *Dinoderus minutus*.

Hautflügler wie

*Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*.

Termiten wie

- 5     *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*.

Borstenschwänze wie *Lepisma saccharina*.

10

Unter technischen Materialien sind im vorliegenden Zusammenhang nicht-lebende Materialien zu verstehen, wie vorzugsweise Kunststoffe, Klebstoffe, Leime, Papiere und Kartone, Leder, Holz, Holzverarbeitungsprodukte und Anstrichmittel.

- 15     Ganz besonders bevorzugt handelt es sich bei dem vor Insektenbefall zu schützenden Material um Holz und Holzverarbeitungsprodukte.

Unter Holz und Holzverarbeitungsprodukten, welche durch das erfindungsgemäße Mittel bzw. dieses enthaltende Mischungen geschützt werden kann, ist beispielhaft

20

zu verstehen:

Bauholz, Holzbalken, Eisenbahnschwellen, Brückenteile, Bootsstege, Holzfahrzeuge, Kisten, Paletten, Container, Telefonmasten, Holzverkleidungen, Holzfenster und -türen, Sperrholz, Spanplatten, Tischlerarbeiten oder Holzprodukte, die ganz allgemein beim Hausbau oder in der Bautischlerei Verwendung finden.

25

Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe können als solche, in Form von Konzentraten oder allgemein üblichen Formulierungen wie Pulver, Granulate, Lösungen, Suspensionen, Emulsionen oder Pasten angewendet werden.

30

Die genannten Formulierungen können in an sich bekannter Weise hergestellt werden, z.B. durch Vermischen der erfindungsgemäßen Wirkstoffe mit mindestens



einem Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgator, Dispergier- und/oder Binde- oder Fixiermittels, Wasser-Repellent, gegebenenfalls Sikkative und UV-Stabilisatoren und gegebenenfalls Farbstoffen und Pigmenten sowie weiteren Verarbeitungshilfsmitteln.

5

Die zum Schutz von Holz und Holzwerkstoffen verwendeten insektiziden Mittel oder Konzentrate enthalten den erfindungsgemäßen Wirkstoff in einer Konzentration von 0,0001 bis 95 Gew.-%, insbesondere 0,001 bis 60 Gew.-%.

10

Die Menge der eingesetzten Mittel bzw. Konzentrate ist von der Art und dem Vorkommen der Insekten und von dem Medium abhängig. Die optimale Einsatzmenge kann bei der Anwendung jeweils durch Testreihen ermittelt werden. Im allgemeinen ist es jedoch ausreichend 0,0001 bis 20 Gew.-%, vorzugsweise 0,001 bis 10 Gew.-%, des Wirkstoffs, bezogen auf das zu schützende Material, einzusetzen.

15

Als Lösungs- und/oder Verdünnungsmittel dient ein organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein öliges oder ölartiges schwer flüchtiges organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder ein polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch und/oder Wasser und gegebenenfalls einen Emulgator und/oder Netzmittel.

20

Als organisch-chemische Lösungsmittel werden vorzugsweise ölige oder ölartige Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, eingesetzt. Als derartige schwerflüchtige, wasserunlösliche, ölige und ölartige Lösungsmittel werden entsprechende Mineralöle oder deren Aromatenfraktionen oder mineralöhlhaltige Lösungsmittelgemische, vorzugsweise Testbenzin, Petroleum und/oder Alkylbenzol verwendet.

25

Vorteilhaft gelangen Mineralöle mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Testbenzin mit einem Siedebereich von 170 bis 220°C, Spindelöl mit einem Siedebereich von 250 bis 350°C, Petroleum bzw. Aromaten vom Siedebereich von 160 bis 280°C, Terpentinöl und dgl. zum Einsatz.

30

In einer bevorzugten Ausführungsform werden flüssige aliphatische Kohlenwasserstoffe mit einem Siedebereich von 180 bis 210°C oder hochsiedende Gemische von aromatischen und aliphatischen Kohlenwasserstoffen mit einem Siedebereich von 180 bis 220°C und/oder Spindelöl und/oder Monochlornaphthalin, vorzugsweise  $\alpha$ -Monochlornaphthalin, verwendet.

Die organischen schwerflüchtigen öligen oder ölartigen Lösungsmittel mit einer Verdunstungszahl über 35 und einem Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, können teilweise durch leicht oder mittelflüchtige organisch-chemische Lösungsmittel ersetzt werden, mit der Maßgabe, dass das Lösungsmittelgemisch ebenfalls eine Verdunstungszahl über 35 und einen Flammpunkt oberhalb 30°C, vorzugsweise oberhalb 45°C, aufweist und dass das Insektizid-Fungizid-Gemisch in diesem Lösungsmittelgemisch löslich oder emulgierbar ist.

Nach einer bevorzugten Ausführungsform wird ein Teil des organisch-chemischen Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisches oder ein aliphatisches polares organisch-chemisches Lösungsmittel oder Lösungsmittelgemisch ersetzt. Vorzugsweise gelangen Hydroxyl- und/oder Ester- und/oder Ethergruppen enthaltende aliphatische organisch-chemische Lösungsmittel wie beispielsweise Glycolether, Ester oder dgl. zur Anwendung.

Als organisch-chemische Bindemittel werden im Rahmen der vorliegenden Erfindung die an sich bekannten wasserverdünnbaren und/oder in den eingesetzten organisch-chemischen Lösungsmitteln löslichen oder dispergier- bzw. emulgierbaren Kunstharze und/oder bindende trocknende Öle, insbesondere Bindemittel bestehend aus oder enthaltend ein Acrylatharz, ein Vinylharz, z.B. Polyvinylacetat, Polyesterharz, Polykondensations- oder Polyadditionsharz, Polyurethanharz, Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz, Phenolharz, Kohlenwasserstoffharz wie Inden-Cumaronharz, Siliconharz, trocknende pflanzliche und/oder trocknende Öle und/oder physikalisch trocknende Bindemittel auf der Basis eines Natur- und/oder Kunstharzes verwendet.

Das als Bindemittel verwendete Kunstharz kann in Form einer Emulsion, Dispersion oder Lösung, eingesetzt werden. Als Bindemittel können auch Bitumen oder bituminöse Substanzen bis zu 10 Gew.-%, verwendet werden. Zusätzlich können an sich bekannte Farbstoffe, Pigmente, wasserabweisende Mittel, Geruchskorrigentien und Inhibitoren bzw. Korrosionsschutzmittel und dgl. eingesetzt werden.

Bevorzugt ist gemäß der Erfindung als organisch-chemische Bindemittel mindestens ein Alkydharz bzw. modifiziertes Alkydharz und/oder ein trocknendes pflanzliches Öl im Mittel oder im Konzentrat enthalten. Bevorzugt werden gemäß der Erfindung Alkydharze mit einem Ölgehalt von mehr als 45 Gew.-%, vorzugsweise 50 bis 68 Gew.-%, verwendet.

Das erwähnte Bindemittel kann ganz oder teilweise durch ein Fixierungsmittel(gemisch) oder ein Weichmacher(gemisch) ersetzt werden. Diese Zusätze sollen einer Verflüchtigung der Wirkstoffe sowie einer Kristallisation bzw. Ausfällen vorbeugen. Vorzugsweise ersetzen sie 0,01 bis 30 % des Bindemittels (bezogen auf 100 % des eingesetzten Bindemittels).

Die Weichmacher stammen aus den chemischen Klassen der Phthalsäureester wie Dibutyl-, Dioctyl- oder Benzylbutylphthalat, Phosphorsäureester wie Tributylphosphat, Adipinsäureester wie Di-(2-ethylhexyl)-adipat, Stearate wie Butylstearat oder Amylstearat, Oleate wie Butyloleat, Glycerinether oder höhermolekulare Glykolether, Glycerinester sowie p-Toluolsulfonsäureester.

Fixierungsmittel basieren chemisch auf Polyvinylalkylethern wie z.B. Polyvinylmethylether oder Ketonen wie Benzophenon, Ethylenbenzophenon.

Als Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel kommt insbesondere auch Wasser in Frage, gegebenenfalls in Mischung mit einem oder mehreren der oben genannten organisch-chemischen Lösungs- bzw. Verdünnungsmittel, Emulgatoren und Dispergatoren.

Ein besonders effektiver Holzschutz wird durch großtechnische Imprägnierverfahren, z.B. Vakuum, Doppelvakuum oder Druckverfahren, erzielt.

5 Die anwendungsfertigen Mittel können gegebenenfalls noch weitere Insektizide und gegebenenfalls noch ein oder mehrere Fungizide enthalten.

Als zusätzliche Zumischpartner kommen vorzugsweise die in der WO 94/29 268 genannten Insektizide und Fungizide in Frage. Die in diesem Dokument genannten Verbindungen sind ausdrücklicher Bestandteil der vorliegenden Anmeldung.

10

Als ganz besonders bevorzugte Zumischpartner können Insektizide, wie Chlorpyrifos, Phoxim, Silafluofin, Alphamethrin, Cyfluthrin, Cypermethrin, Deltamethrin, Permethrin, Imidacloprid, NI-25, Flufenoxuron, Hexaflumuron, Transfluthrin, Thiacloprid, Methoxyphenoxid und Triflumuron, sowie Fungizide wie  
15 Epoxyconazole, Hexaconazole, Azaconazole, Propiconazole, Tebuconazole, Cyproconazole, Metconazole, Imazalil, Dichlorfluanid, Tolyfluanid, 3-Iod-2-propinylbutylcarbamate, N-Octyl-isothiazolin-3-on und 4,5-Dichlor-N-octylisothiazolin-3-on, sein.

20 Zugleich können die erfindungsgemäßen Verbindungen zum Schutz vor Bewuchs von Gegenständen, insbesondere von Schiffskörpern, Sieben, Netzen, Bauwerken, Kaianlagen und Signalanlagen, welche mit See- oder Brackwasser in Verbindung kommen, eingesetzt werden.

25 Bewuchs durch sessile Oligochaeten, wie Kalkröhrenwürmer sowie durch Muscheln und Arten der Gruppe Ledamorpha (Entenmuscheln), wie verschiedene Lepas- und Scalpellum-Arten, oder durch Arten der Gruppe Balanomorpha (Seepocken), wie Balanus- oder Pollicipes-Species, erhöht den Reibungswiderstand von Schiffen und führt in der Folge durch erhöhten Energieverbrauch und darüber hinaus durch häufige  
30 Trockendockaufenthalte zu einer deutlichen Steigerung der Betriebskosten.

Neben dem Bewuchs durch Algen, beispielsweise *Ectocarpus* sp. und *Ceramium* sp., kommt insbesondere dem Bewuchs durch sessile Entomostraken-Gruppen, welche unter dem Namen Cirripedia (Rankenflussskrebse) zusammengefasst werden, besondere Bedeutung zu.

5

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass die erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, eine hervorragende Antifouling (Antibewuchs)-Wirkung aufweisen.

- 10 Durch Einsatz von erfindungsgemäßen Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Wirkstoffen, kann auf den Einsatz von Schwermetallen wie z.B. in Bis(trialkylzinn)-sulfiden, Tri-*n*-butylzinnlaurat, Tri-*n*-butylzinnschlorid, Kupfer(I)-oxid, Triethylzinnschlorid, Tri-*n*-butyl(2-phenyl-4-chlorphenoxy)-zinn, Tributylzinnoxid, Molybdändisulfid, Antimonoxid, polymerem Butyltitanat, Phenyl-
- 15 (bispyridin)-wismutchlorid, Tri-*n*-butylzinnsfluorid, Manganethylenbisthiocarbamat, Zinkdimethyldithiocarbamat, Zinkethylenbisthiocarbamat, Zink- und Kupfersalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Bisdimethyldithiocarbamoylzinkethylenbisthiocarbamat, Zinkoxid, Kupfer(I)-ethylen-bisdithiocarbamat, Kupferthiocyanat, Kupfernaphthenat und Tributylzinnsalogeniden verzichtet werden oder die Konzentration dieser Ver-
- 20 bindungen entscheidend reduziert werden.

Die anwendungsfertigen Antifoulingfarben können gegebenenfalls noch andere Wirkstoffe, vorzugsweise Algizide, Fungizide, Herbizide, Molluskizide bzw. andere Antifouling-Wirkstoffe enthalten.

25

Als Kombinationspartner für die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel eignen sich vorzugsweise:

Algizide wie

- 30 2-*tert*.-Butylamino-4-cyclopropylamino-6-methylthio-1,3,5-triazin, Dichlorophen, Diuron, Endothal, Fentinacetat, Isoproturon, Methabenzthiazuron, Oxyfluorfen, Quinoclamine und Terbutryn;

Fungizide wie

Benzo[b]thiophencarbonsäurecyclohexylamid-S,S-dioxid, Dichlofluanid, Fluorfolpet, 3-Iod-2-propinyl-butylcarbammat, Tolyfluanid und Azole wie

5 Azaconazole, Cyproconazole, Epoxyconazole, Hexaconazole, Metconazole, Propiconazole und Tebuconazole;

Molluskizide wie

Fentinacetat, Metaldehyd, Methiocarb, Niclosamid, Thiodicarb und Trimethacarb;

oder herkömmliche Antifouling-Wirkstoffe wie

10 4,5-Dichlor-2-octyl-4-isothiazolin-3-on, Diiodmethylparatrylsulfon, 2-(N,N-Dimethylthiocarbamoylthio)-5-nitrothiazyl, Kalium-, Kupfer-, Natrium- und Zinksalze von 2-Pyridinthiol-1-oxid, Pyridin-triphenylboran, Tetrabutyl-distannoxan, 2,3,5,6-Tetrachlor-4-(methylsulfonyl)-pyridin, 2,4,5,6-Tetrachloroisophthalonitril, Tetramethylthiuramdisulfid und 2,4,6-Trichlorphenylmaleinimid.

15 Die verwendeten Antifouling-Mittel enthalten die erfindungsgemäßen Wirkstoff der erfindungsgemäßen Verbindungen in einer Konzentration von 0,001 bis 50 Gew.-%, insbesondere von 0,01 bis 20 Gew.-%.

20 Die erfindungsgemäßen Antifouling-Mittel enthalten des weiteren die üblichen Bestandteile wie z.B. in Ungerer, *Chem. Ind.* 1985, 37, 730-732 und Williams, *Antifouling Marine Coatings*, Noyes, Park Ridge, 1973 beschrieben.

Antifouling-Anstrichmittel enthalten neben den algiziden, fungiziden, molluskiziden und erfindungsgemäßen insektiziden Wirkstoffen insbesondere Bindemittel.

25

Beispiele für anerkannte Bindemittel sind Polyvinylchlorid in einem Lösungsmittelsystem, chlorierter Kautschuk in einem Lösungsmittelsystem, Acrylharze in einem Lösungsmittelsystem insbesondere in einem wässrigen System, Vinylchlorid/Vinylacetat-Copolymersysteme in Form wässriger Dispersionen oder in Form von organischen Lösungsmittelsystemen, Butadien/Styrol/Acrylnitril-Kautschuke, trocknende Öle, wie Leinsamenöl, Harzester oder modifizierte Hartharze in Kombination

30

mit Teer oder Bitumina, Asphalt sowie Epoxy-Verbindungen, geringe Mengen Chlorkautschuk, chloriertes Polypropylen und Vinylharze.

5 Gegebenenfalls enthalten Anstrichmittel auch anorganische Pigmente, organische Pigmente oder Farbstoffe, welche vorzugsweise in Seewasser unlöslich sind. Ferner können Anstrichmittel Materialien, wie Kolophonium enthalten, um eine gesteuerte Freisetzung der Wirkstoffe zu ermöglichen. Die Anstriche können ferner Weichmacher, die rheologischen Eigenschaften beeinflussende Modifizierungsmittel sowie andere herkömmliche Bestandteile enthalten. Auch in Self-Polishing-Antifouling-Systemen können die erfindungsgemäßen Verbindungen oder die oben genannten Mischungen eingearbeitet werden.

15 Die erfindungsgemäßen Wirkstoffe eignen sich auch zur Bekämpfung von tierischen Schädlingen, insbesondere von Insekten, Spinnentieren und Milben, die in geschlossenen Räumen, wie beispielsweise Wohnungen, Fabrikhallen, Büros, Fahrzeugkabinen u.ä. vorkommen. Sie können zur Bekämpfung dieser Schädlinge allein oder in Kombination mit anderen Wirk- und Hilfsstoffen in Haushaltsinsektizid-Produkten verwendet werden. Sie sind gegen sensible und resistente Arten sowie gegen alle Entwicklungsstadien wirksam. Zu diesen Schädlingen gehören:

20

Aus der Ordnung der Scorpionidea z.B. *Buthus occitanus*.

Aus der Ordnung der Acarina z.B. *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

25

Aus der Ordnung der Araneae z.B. *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Aus der Ordnung der Opiliones z.B. *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Aus der Ordnung der Isopoda z.B. *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

30

Aus der Ordnung der Diplopoda z.B. *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp..

Aus der Ordnung der Chilopoda z.B. *Geophilus* spp..

Aus der Ordnung der Zygentoma z.B. *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

Aus der Ordnung der Blattaria z.B. *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

Aus der Ordnung der Saltatoria z.B. *Acheta domesticus*.

Aus der Ordnung der Dermaptera z.B. *Forficula auricularia*.

Aus der Ordnung der Isoptera z.B. *Kaloterme* spp., *Reticuliterme* spp.

10 Aus der Ordnung der Psocoptera z.B. *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

Aus der Ordnung der Coleoptera z.B. *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

15 Aus der Ordnung der Diptera z.B. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysosoma pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

20 Aus der Ordnung der Lepidoptera z.B. *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Aus der Ordnung der Siphonaptera z.B. *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

25 Aus der Ordnung der Hymenoptera z.B. *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

Aus der Ordnung der Anoplura z.B. *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phthirus pubis*.

Aus der Ordnung der Heteroptera z.B. *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

30

Die Anwendung im Bereich der Haushaltsinsektizide erfolgt allein oder in Kombination mit anderen geeigneten Wirkstoffen wie Phosphorsäureestern, Carbamaten,



Pyrethroiden, Wachstumsregulatoren oder Wirkstoffen aus anderen bekannten Insektizidklassen.

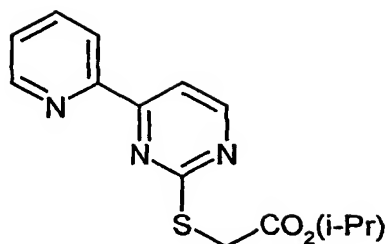
5 Die Anwendung erfolgt in Aerosolen, drucklosen Sprühmitteln, z.B. Pump- und Zerstäubersprays, Nebelautomaten, Foggern, Schäumen, Gelen, Verdampferprodukten mit Verdampferplättchen aus Cellulose oder Kunststoff, Flüssigverdampfern, Gel- und Membranverdampfern, propellergetriebenen Verdampfern, energielosen bzw. passiven Verdampfungssystemen, Mottenpapieren, Mottensäckchen und Mottengelen, als Granulate oder Stäube, in Streuködern oder Köderstationen.

10

Die Herstellung und die Verwendung der erfindungsgemäßen Stoffe geht aus den folgenden Beispielen hervor.

## Herstellungsbeispiele

### Beispiel 1



5

0,57 g (3 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 1,66 g (12 mmol) Kaliumcarbonat werden in 30 ml Acetonitril vorgelegt. Nach Zugabe von 0,41 g (3 mmol) 2-Chloressigsäureisopropylester wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch unter vermindertem Druck eingeeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

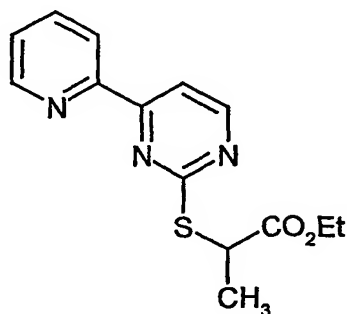
10

Man erhält 0,72 g (79 % d. Th.) an Isopropyl-4-([4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio)butanoat als Oel.

15

HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,56.

### Beispiel 2



20

35,6 mg (0,188 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 104 mg (0,752 mmol) Kaliumcarbonat werden in 5 ml Tetrahydrofuran vorgelegt. Nach Zugabe von

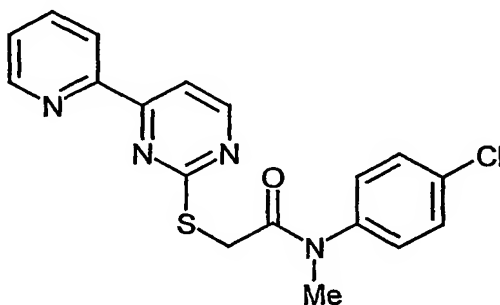
34,0 mg (0,188 mmol) 2-Brompropionsäureethylester wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung werden 0,5 ml Wasser und 2 ml Essigsäureethylester zugesetzt, 30 min gerührt und das Reaktionsgemisch über eine Extrelut-Kieselgelkartusche gegeben und anschließend unter vermindertem Druck eingeeengt.

5 Man erhält 41 mg (70 % d. Th.) an Ethyl-2-{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}-propanoat.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,74.

### Beispiel 3

10



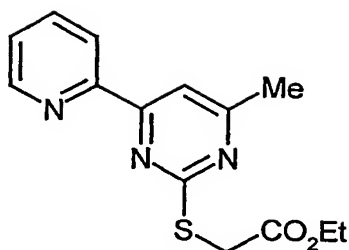
0,57 g (3 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 1,66 g (12 mmol) Kaliumcarbonat werden in 30 ml Acetonitril vorgelegt. Nach Zugabe von 0,65 g (3 mmol) N-(4-Chlorphenyl)-N-Methyl-2-chloracetamid wird für 16 h bei 60°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeeengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

15 Man erhält 1,09 g (81 % d. Th.) an N-(4-Chlorphenyl)-N-methyl-2-{[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetamid.

20

HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,73.

Fp. 142°C.

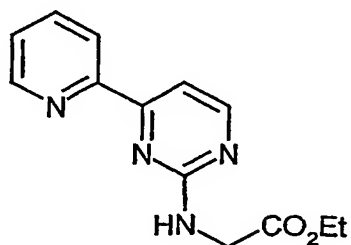
Beispiel 4

- 5 0,30 g (1,04 mmol) Ethyl-[(4-brom-6-methyl-2-pyrimidinyl)thio]acetat, 0,38 g (1,04 mmol) 2-(Tributylstannyl)pyridin und 0,06 g (0,05 mmol) Tetrakis(triphenylphosphin)palladium werden unter Argon in 10 ml Xylol vorgelegt und 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeeengt und das Rohprodukt an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan) chromatographiert.
- 10 Man erhält 0,215 g (70 % d. Th.) an Ethyl-{[4-methyl-6-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]thio}acetat.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 2,45.

Beispiel 5

15



- 20 0,71 g (3 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und 0,33 g (3 mmol) Triethylamin werden in 30 ml Ethanol vorgelegt, mit 0,46 g (3,3 mmol) Glycinethylester-Hydrochlorid versetzt und für 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird das Reaktionsgemisch unter vermindertem Druck eingeeengt, in Dichlormethan aufgenommen, mit Natriumhydrogencarbonatlösung und Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet

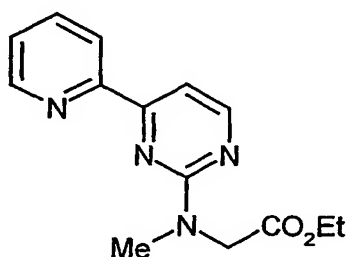
und unter vermindertem Druck eingeengt. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton 95:5) chromatographiert.

Man erhält 0,12 g (13 % d. Th.) an Ethyl-N-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]glycinat.

HPLC            Log P (pH 2,3) = 1,14.

5            Fp.            85°C.

#### Beispiel 6



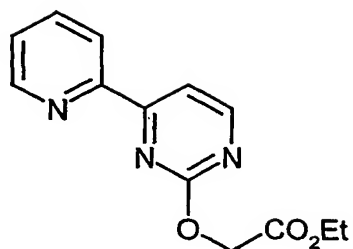
10

0,41 g (1,74 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin und 0,48 g (3,49 mmol) Kaliumcarbonat werden in 20 ml DMF vorgelegt, mit 0,29 g (1,92 mmol) N-Methyl-glycinethylester-Hydrochlorid versetzt und für 16 h bei 80°C gerührt. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeengt, in Dichlormethan aufgenommen, mit Natriumhydrogencarbonatlösung und Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeengt. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton 95:5) chromatographiert.

15

Man erhält 0,14 g (30 % d. Th.) an Ethyl-N-methyl-N-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]glycinat als Oel.

20            HPLC:            Log P (pH 2,3) = 1,66.

Beispiel 7

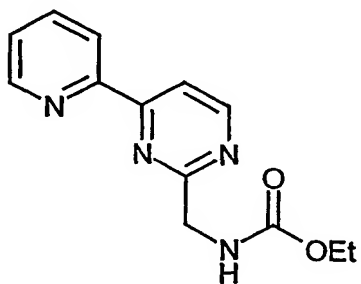
- 5 0,71 g (3 mmol) 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin werden in 3 ml Glykolsäureethylester vorgelegt. Anschließend werden bei einer Temperatur von kleiner 35°C portionsweise 0,18 g (4,5 mmol) Natriumhydrid (60 %ig) zugesetzt. Man rührt 30 min bei Raumtemperatur nach, versetzt dann mit Wasser und extrahiert mit Dichlormethan. Das Rohprodukt wird an Kieselgel (Laufmittel: Dichlormethan/Aceton
- 10 95:5) chromatographiert.

Man erhält 0,39 g (46 % d. Th.) an Ethyl-{{4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl}oxy}acetat.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,73

Fp. 48-53°C

15 Beispiel 8



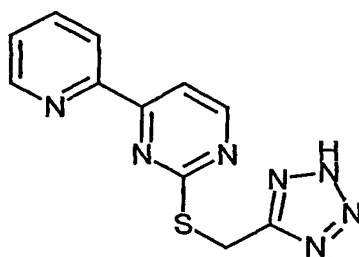
- 0,88 g (5 mmol) 3-(Dimethyl-amino)-1-(2-pyridinyl)-2-propen-1-on, 0,91 g (5 mmol)
- 20 Methyl-2-amino-2-iminoethylcarbamate-Hydrochlorid und 0,68 g (10 mmol) Natriumethylat werden in 20 ml Ethanol vorgelegt und für 16 h refluxiert. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingeengt, in Dichlormethan auf-

genommen, mit Zitronensäurelösung gewaschen, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

Man erhält 0,35 g (25 % d. Th.) an Ethyl-[4-(2-pyridinyl)-2-pyrimidinyl]methylcarbammat.

5 HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,14.

#### Beispiel 9



10

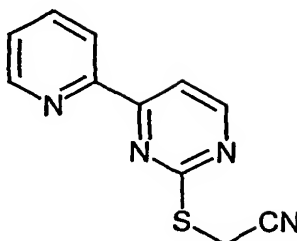
0,6g (2,6 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thioacetonitril und 0,54g (2,6 mmol) Trimethylzinnazid werden in 30 ml Toluol für 16 Stunden unter Rückfluss erhitzt. Zur Aufarbeitung wird eingeeengt, in Natronlauge (10%ig in Wasser) gelöst und zur Entfernung unlöslicher Bestandteile filtriert. Das Filtrat wird mit Salzsäure (10%ig in

15 Wasser) auf pH 4 eingestellt und mit Essigsäureethylester extrahiert. Die organische Phase wird getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt. Zur Entfernung letzter Spuren von Zinnderivaten wird das Rohprodukt in Dichlormethan gelöst und 5 Stunden mit einer gesättigten Kaliumfluoridlösung verrührt. Die organische Phase wird erneut getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

20 Man erhält 0,4g (57% d. Th.) an 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thiomethyl-tetrazol.  
Fp. 162°C.

## Herstellung von Ausgangsstoffen

### Nitrile der Formel (XIV)



5

0,95g (5 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol, 0,75g (10 mmol) Chloracetonitril und 2,46g (30 mmol) Natriumacetat werden in 30 ml Ethanol 6 Stunden unter Rückfluss gekocht und anschließend eingengt. Nach Verteilung zwischen Dichlormethan und Wasser wird die organische Phase abgetrennt, getrocknet und eingengt.

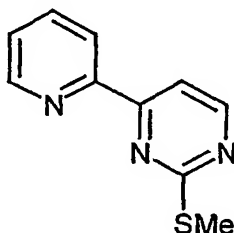
10

Man erhält 0,95g (75% d. Th.) an 4-(2-Pyridinyl)-pyrimidin-2-thioacetonitril.

HPLC: Log P (pH 2,3) = 1,68.

15

### Methylthio-Derivate der Formel (XVI)



20

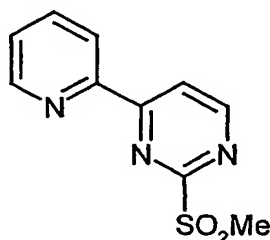
4,73 g (25 mmol) 4-(2-Pyridinyl)-2-pyrimidinthiol und 5,18 g (37,5 mmol) Kaliumcarbonat werden in 50 ml Acetonitril vorgelegt. Man tropft 3,55 g (25 mmol) Iodmethan zu und rührt für 16 h bei 40°C nach. Zur Aufarbeitung wird unter vermindertem Druck eingengt, zwischen Wasser und Methylenchlorid verteilt, die organische Phase getrocknet und unter vermindertem Druck eingengt.



Man erhält 4,45 g (81 % d. Th.) 2-(Methylthio)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin.

HPLC: Log P (pH, 2,3) = 1,93.

5 Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

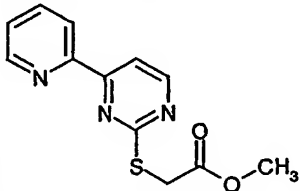
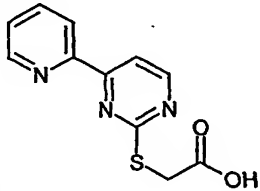
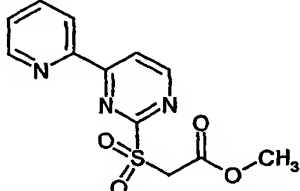
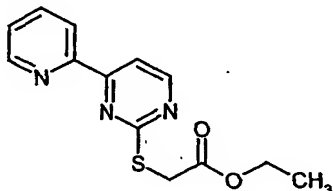
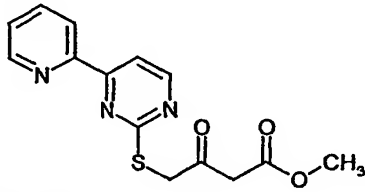
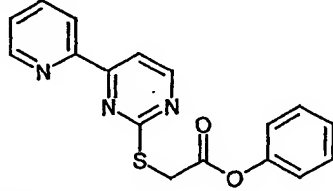
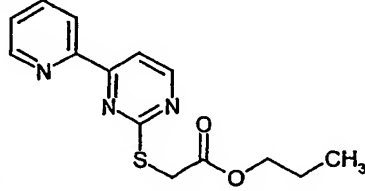


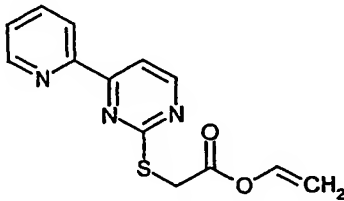
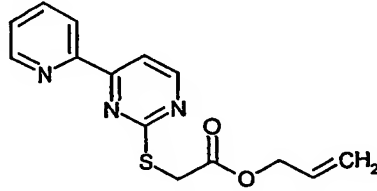
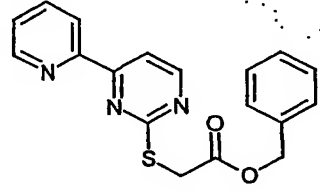
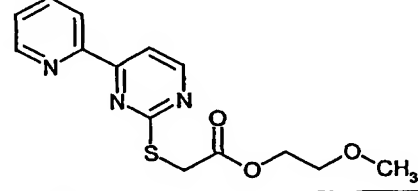
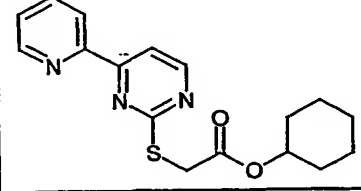
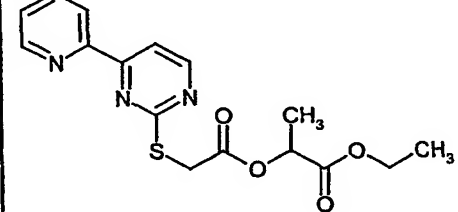
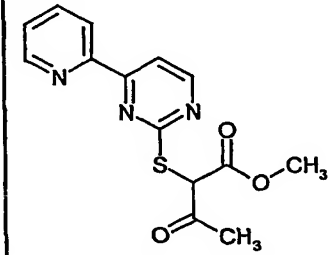
10 4,07 g (20 mmol) 2-(Methylthio)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin werden in 100 ml Dichlormethan gelöst. Man setzt unter Eiskühlung portionsweise 10,85 g (44 mmol) m-Chlorperbenzoesäure (70 %ig) zu und rührt für 16 h bei Raumtemperatur. Die organische Phase wird nacheinander mit gesättigter Natriumhydrogencarbonatlösung und Natriumhydrogensulfitlösung gewaschen, getrocknet und unter vermindertem Druck eingeeengt.

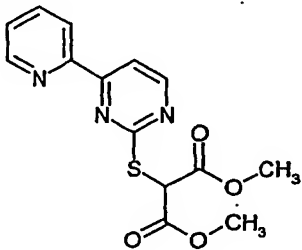
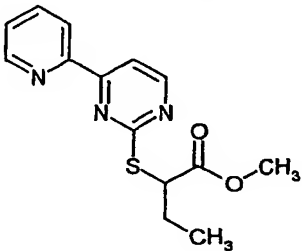
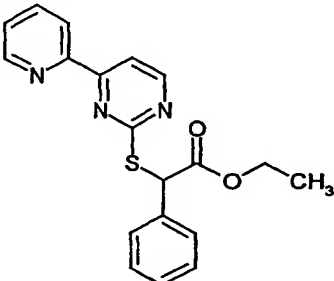
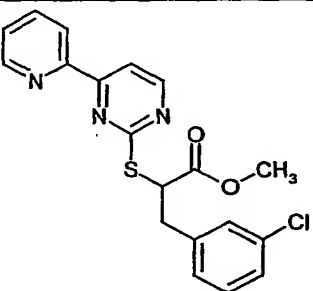
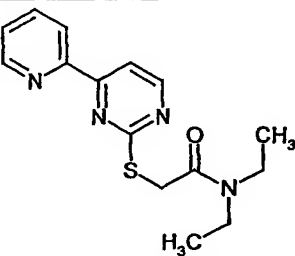
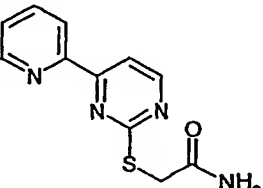
15 Man erhält 3,6 g (53 % d. Th.) an 2-(Methylsulfonyl)-4-(2-pyridinyl)pyrimidin.

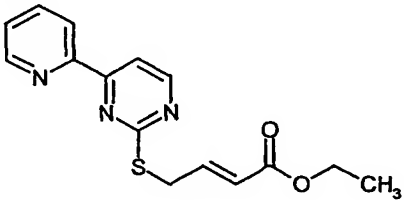
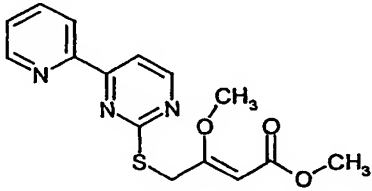
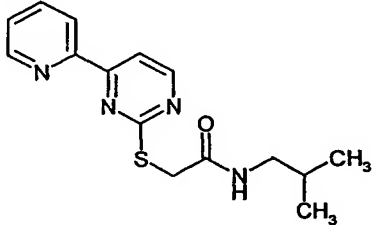
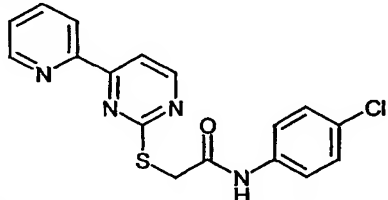
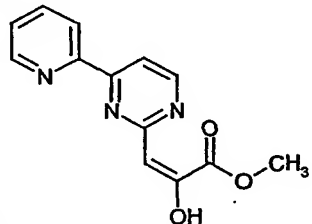
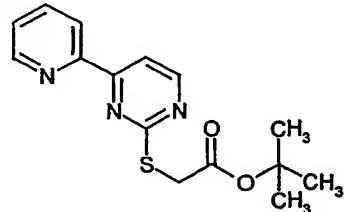
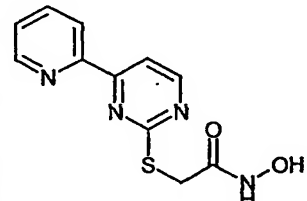
HPLC: Log P (pH 2,3) = 0,99.

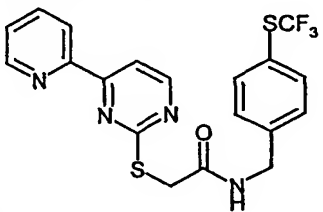
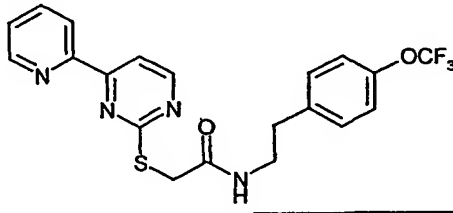
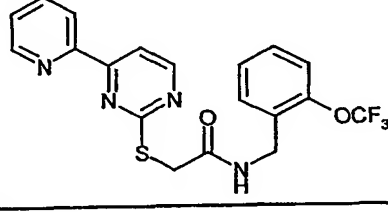
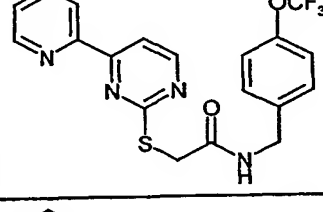
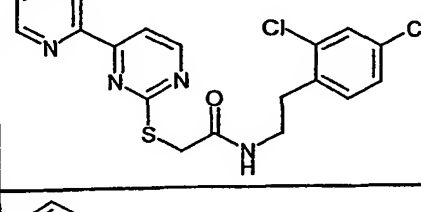
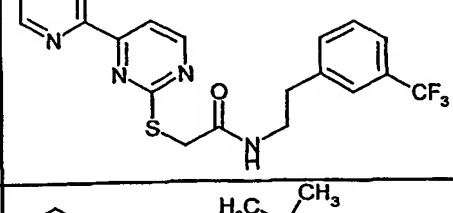
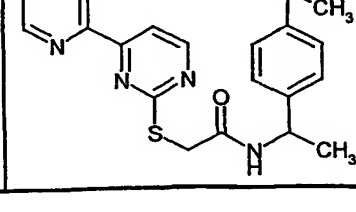
Die in der folgenden Tabelle aufgeführten Verbindungen können entsprechend einem der oben beschriebenen erfindungsgemäßen Verfahren hergestellt werden.

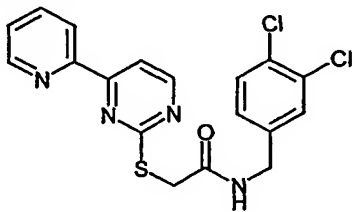
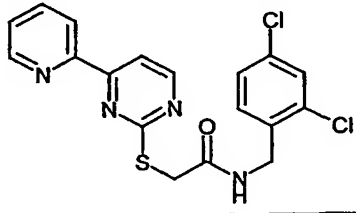
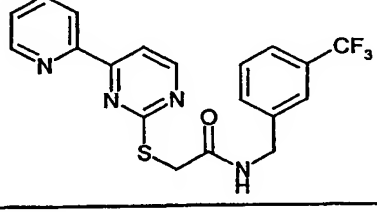
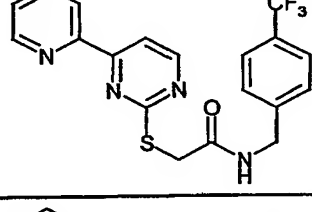
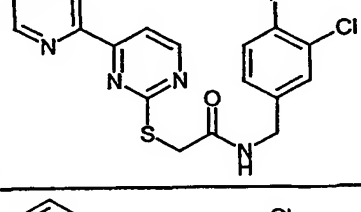
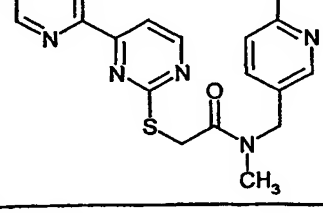
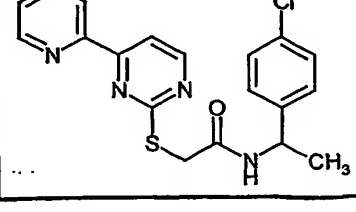
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 10  |    | 1.81              | 95     |
| 11  |    | 1.14              | 181    |
| 12  |    | 1.37              | 125    |
| 13  |   | 2.17              | 78-80  |
| 14  |  | 1.76              |        |
| 15  |  | 2.88              |        |
| 16  |  | 2.76              |        |

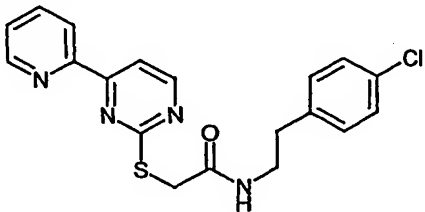
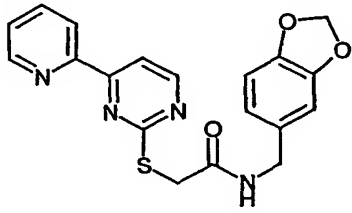
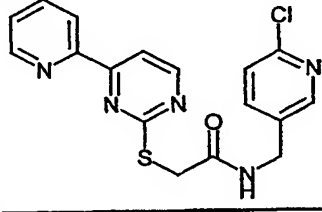
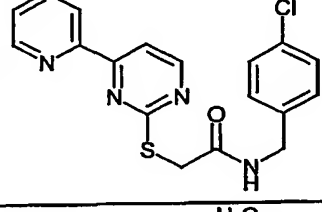
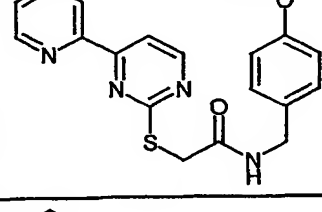
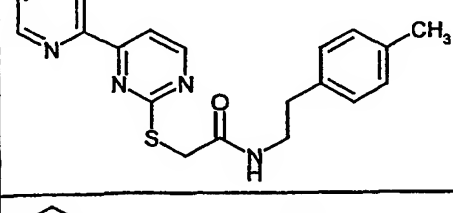
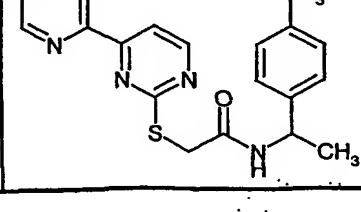
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 17  |    | 2.34              | 108    |
| 18  |    | 2.40              | 68     |
| 19  |    | 2.99              | 88     |
| 20  |   | 1.97              |        |
| 21  |  | 3.53              |        |
| 22  |  | 2.58              |        |
| 23  |  | 2.34              | 95     |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 24  |    | 2.16              |        |
| 25  |    | 2.68              |        |
| 26  |   | 3.50              | 118    |
| 27  |  | 3.84              |        |
| 28  |  | 1.80              | 120    |
| 29  |  | 0.69              | 172    |

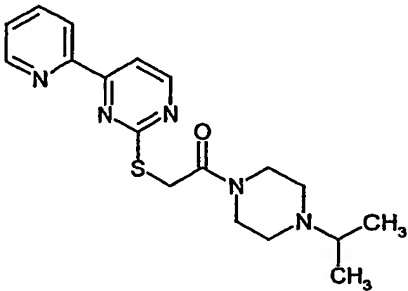
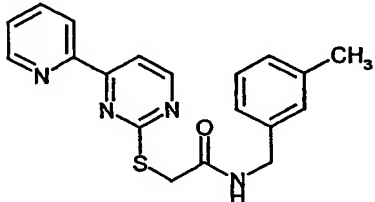
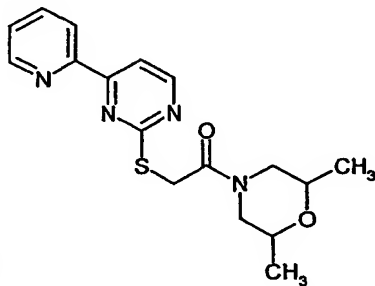
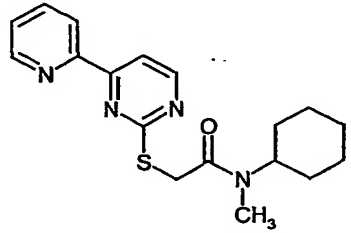
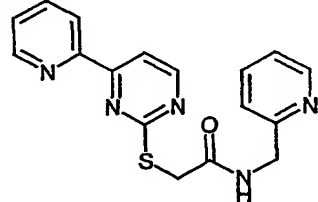
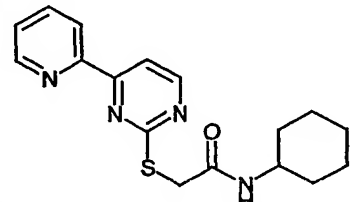
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 30  |    | 2.92              |        |
| 31  |    | 2.70              |        |
| 32  |    | 1.81              |        |
| 33  |   | 2.58              |        |
| 34  |  | 1.89              | 183    |
| 35  |  | 2.96              | 86     |
| 36  |  | 0.55              | 157    |

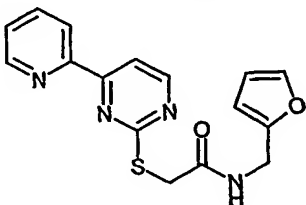
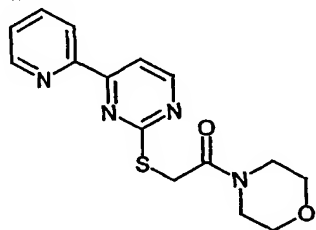
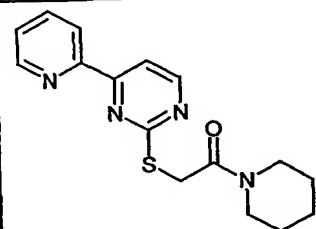
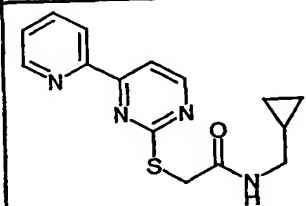
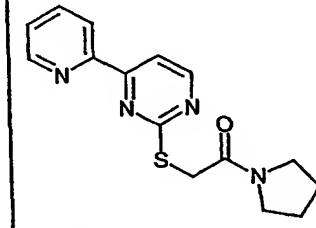
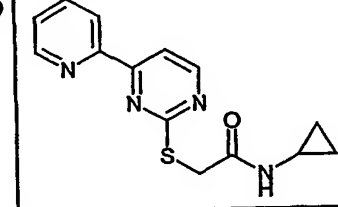
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 37  |    | 2.93              |        |
| 38  |    | 2.96              |        |
| 39  |    | 2.72              |        |
| 40  |  | 2.76              |        |
| 41  |  | 2.83              |        |
| 42  |  | 2.82              |        |
| 43  |  | 3.40              |        |

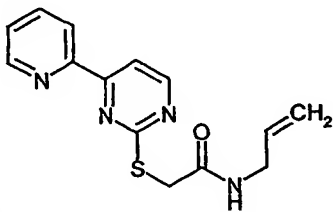
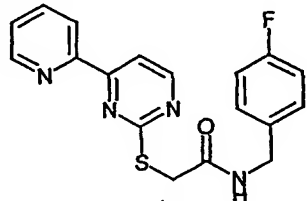
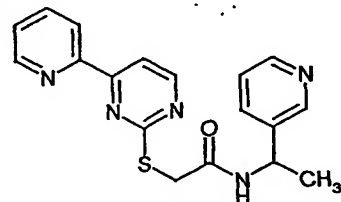
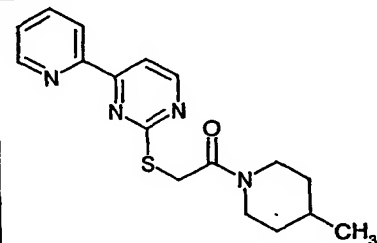
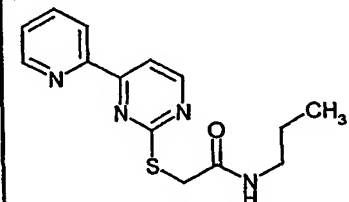
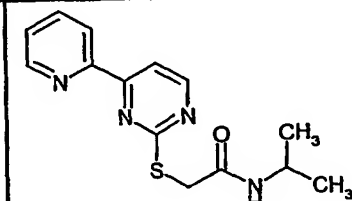
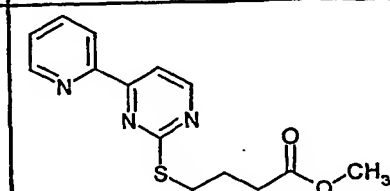
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 44  |    | 2.64              |        |
| 45  |    | 2.69              |        |
| 46  |    | 2.62              |        |
| 47  |  | 2.64              |        |
| 48  |  | 2.42              |        |
| 49  |  | 2.01              |        |
| 50  |  | 2.58              |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 51  |    | 2.58              |        |
| 52  |    | 1.94              |        |
| 53  |    | 1.71              |        |
| 54  |  | 2.38              |        |
| 55  |  | 2.00              |        |
| 56  |  | 2.56              |        |
| 57  |  | 2.48              |        |



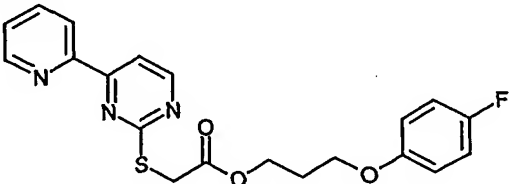
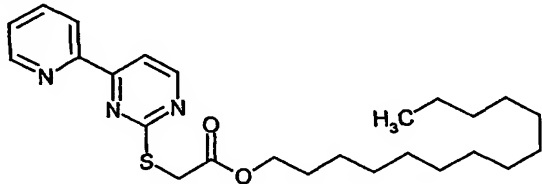
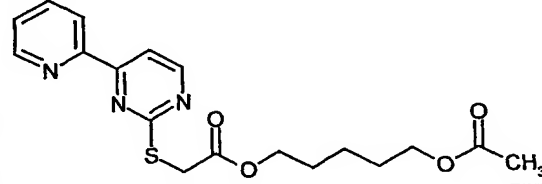
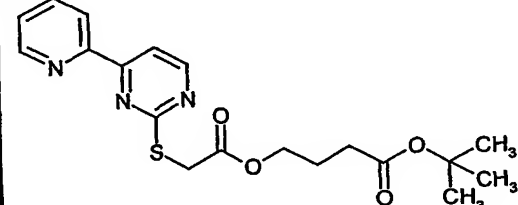
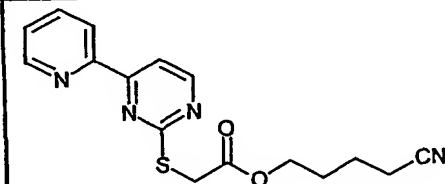
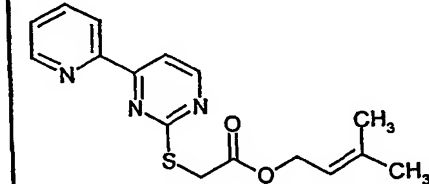
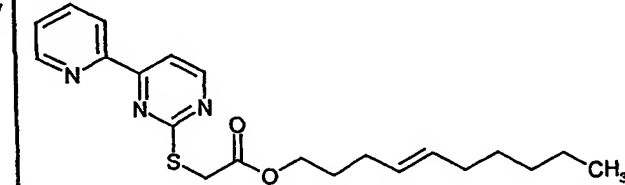
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 58  |    | 0.95              |        |
| 59  |    | 2.29              |        |
| 60  |   | 1.94              |        |
| 61  |  | 2.67              |        |
| 62  |  | 1.14              |        |
| 63  |  | 2.31              |        |

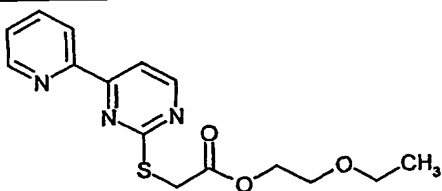
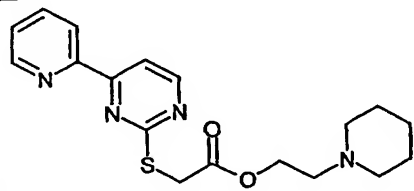
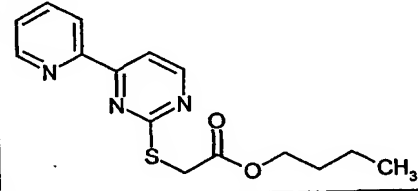
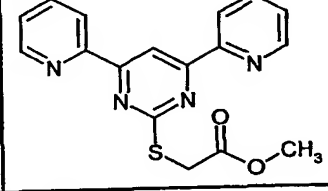
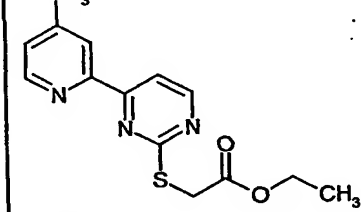
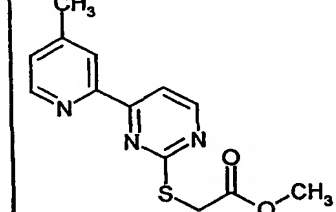
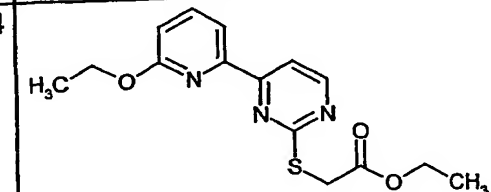
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 64  |    | 1.82              |        |
| 65  |    | 1.55              |        |
| 66  |   | 2.09              |        |
| 67  |  | 1.83              |        |
| 68  |  | 1.75              |        |
| 69  |  | 1.56              |        |

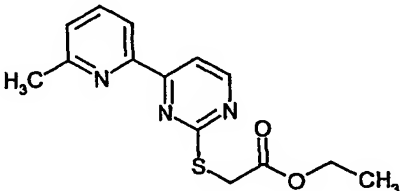
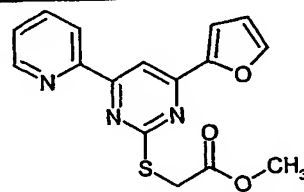
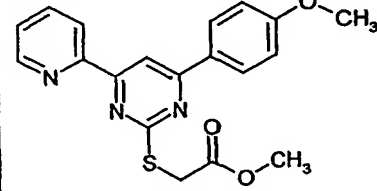
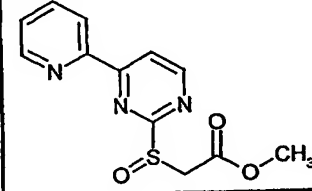
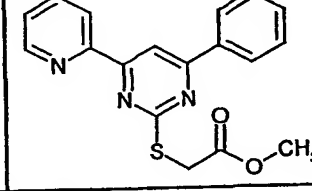
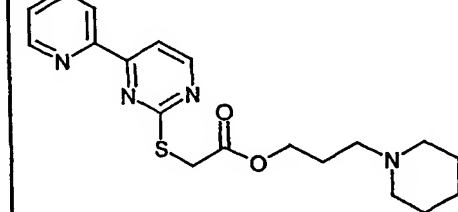
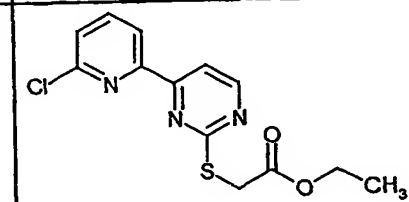
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 70  |    | 1.65              |        |
| 71  |    |                   |        |
| 72  |    |                   |        |
| 73  |   |                   |        |
| 74  |  |                   |        |
| 75  |  |                   |        |
| 76  |  | 2.35              |        |

| Nr. | Struktur | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|----------|-------------------|--------|
| 77  |          | 3.46              | 136    |
| 78  |          | 2.13              | 87-95  |
| 79  |          | 2.68              |        |
| 80  |          | 3.96              |        |
| 81  |          |                   |        |
| 82  |          |                   |        |
| 83  |          | 3.37              |        |

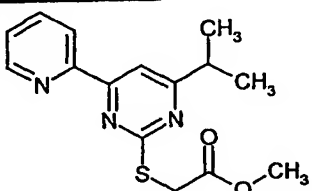
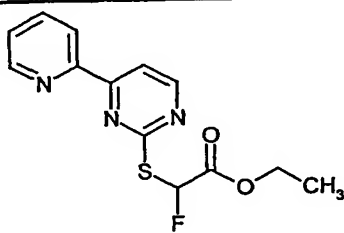
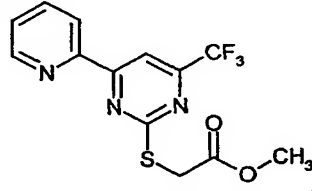
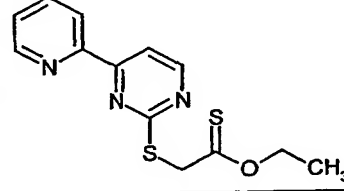
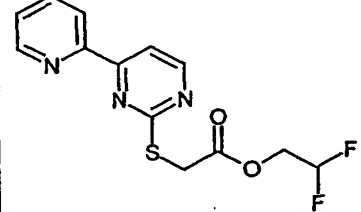
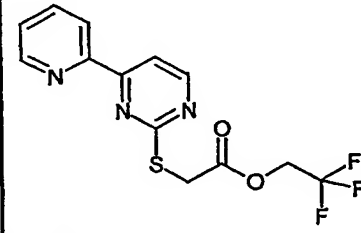
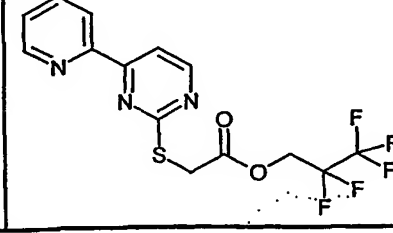
| Nr. | Struktur | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|----------|-------------------|--------|
| 84  |          | 2.72              |        |
| 85  |          | 6.15              |        |
| 86  |          | 7.22              |        |
| 87  |          |                   |        |
| 88  |          | 3.86              |        |
| 89  |          | 3.56              |        |
| 90  |          |                   |        |

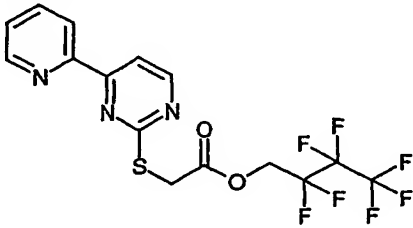
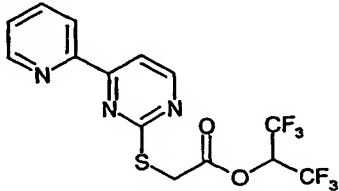
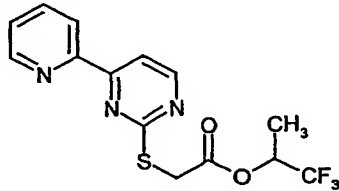
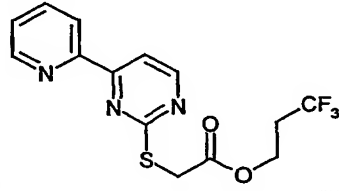
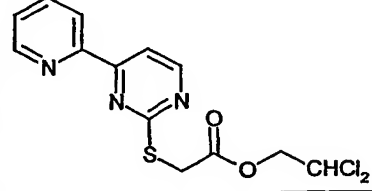
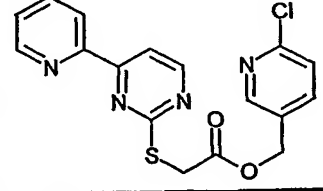
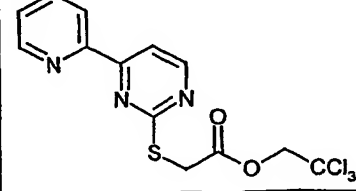
| Nr. | Struktur   | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|--|-------------------|--------|
| 91  |     | 3.59              |        |
| 92  |     |                   |        |
| 93  |     | 2.82              |        |
| 94  |    | 3.48              |        |
| 95  |   | 2.29              |        |
| 96  |   | 3.18              |        |
| 97  |  |                   |        |

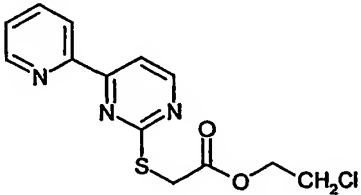
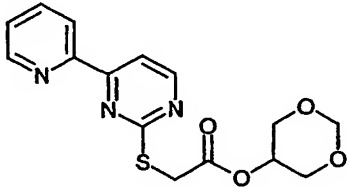
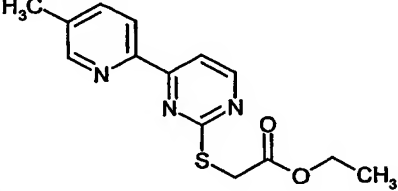
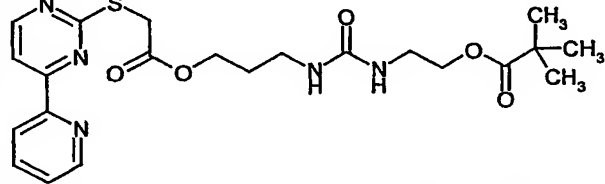
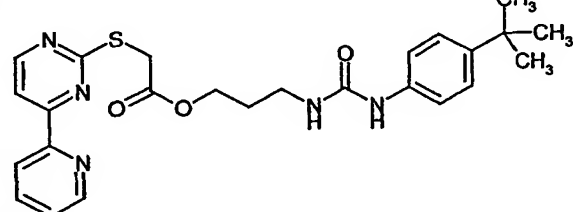
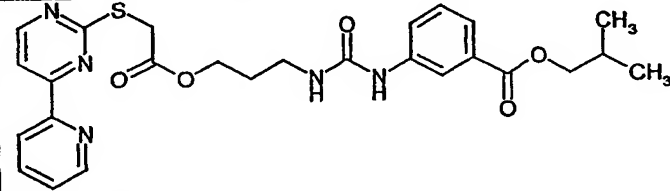
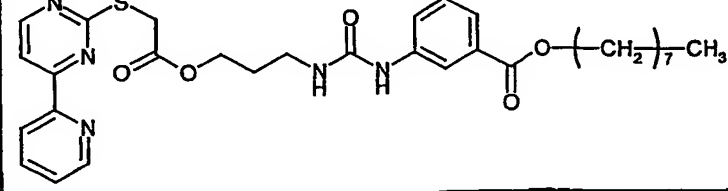
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 98  |    | 2.34              |        |
| 99  |    | 1.04              |        |
| 100 |    | 3.07              |        |
| 101 |   | 2.81              | 117    |
| 102 |  | 2.20              | 60     |
| 103 |  | 1.80              | 105    |
| 104 |  | 3.67              |        |

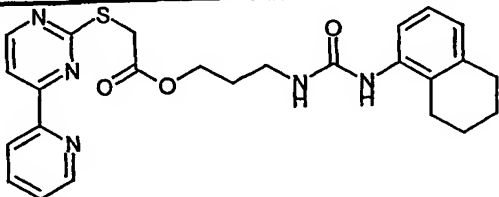
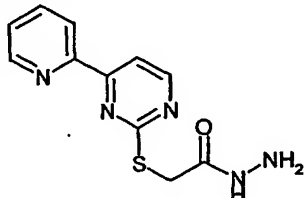
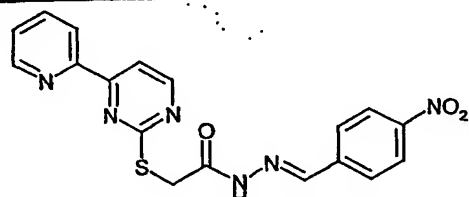
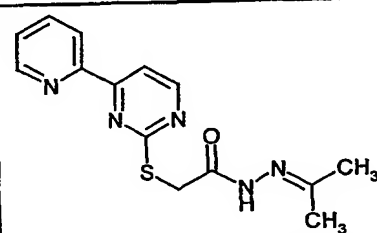
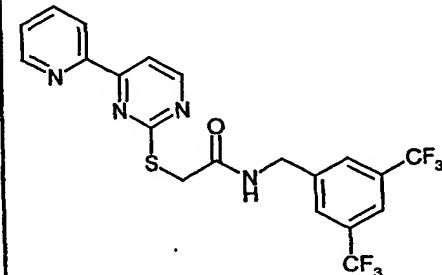
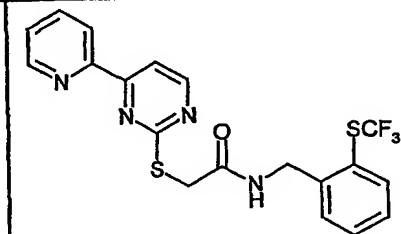
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 105 |    | 2.46              |        |
| 106 |    | 3.01              |        |
| 107 |    | 3.50              |        |
| 108 |   | 0.89              |        |
| 109 |  | 3.57              |        |
| 110 |  | 1.13              |        |
| 111 |  | 3.19              |        |

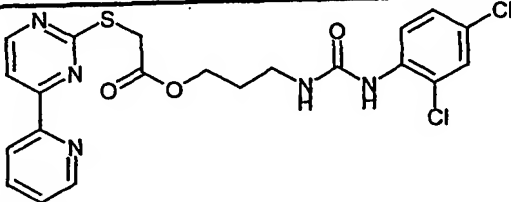
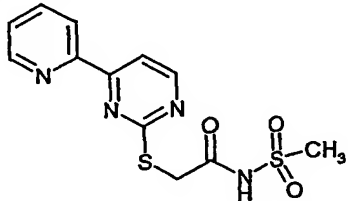
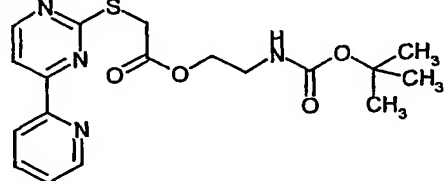
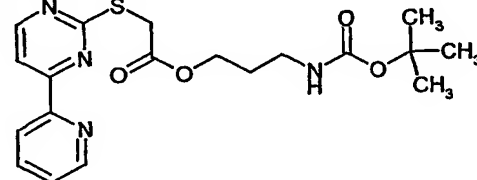
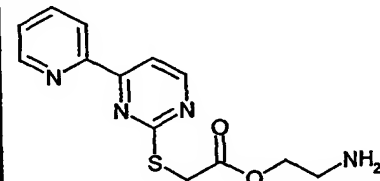
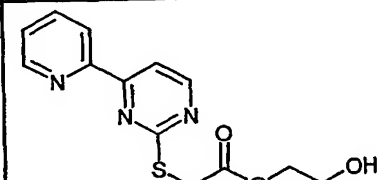
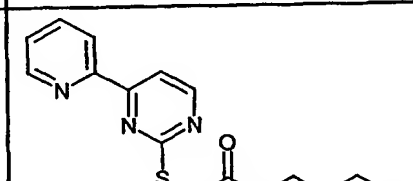


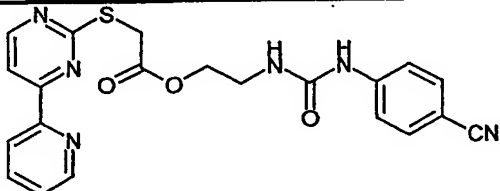
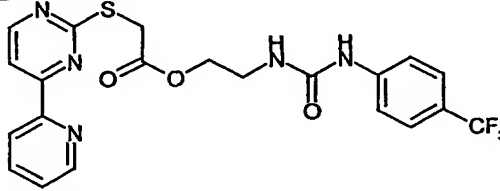
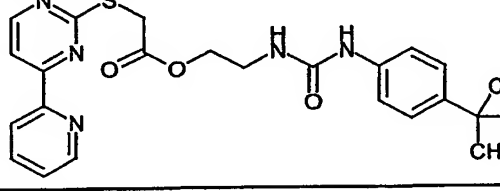
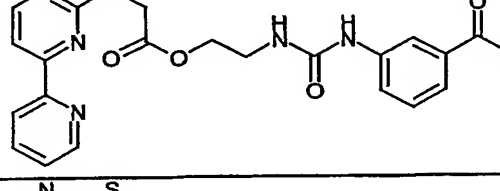
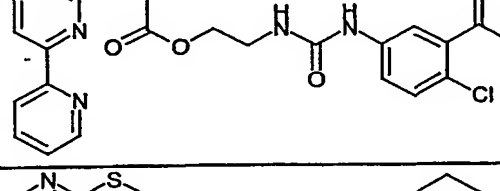
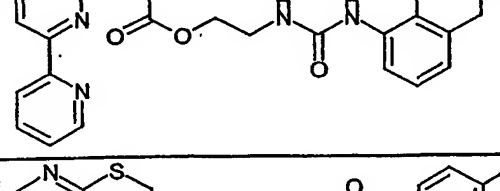
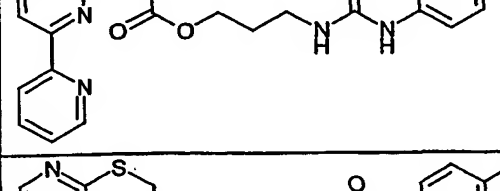
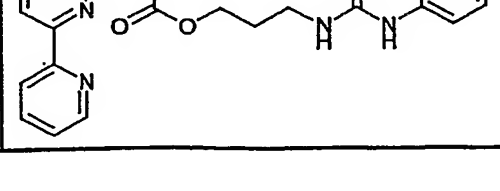
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 112 |    | 3.11              |        |
| 113 |    | 2.55              |        |
| 114 |    | 3.34              |        |
| 115 |   | 3.30              |        |
| 116 |  | 2.25              |        |
| 117 |  | 2.69              |        |
| 118 |  | 3.24              |        |

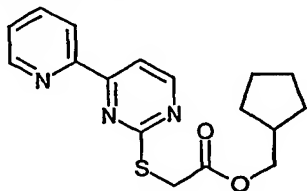
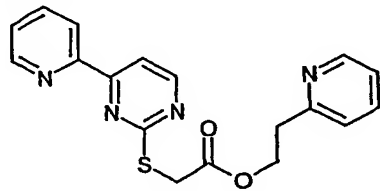
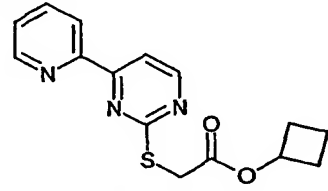
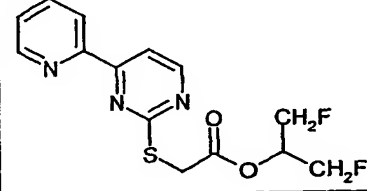
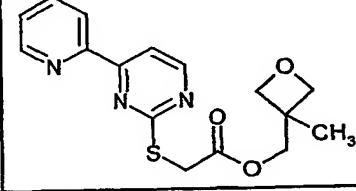
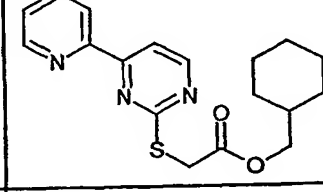
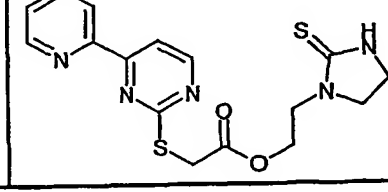
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 119 |    | 3.37              |        |
| 120 |    | 3.59              |        |
| 121 |    | 3.06              |        |
| 122 |   | 2.26              |        |
| 123 |  | 2.78              |        |
| 124 |  | 2.31              |        |
| 125 |  | 3.31              |        |

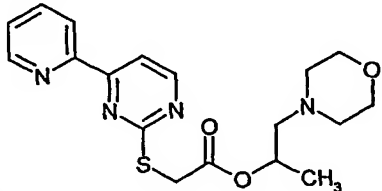
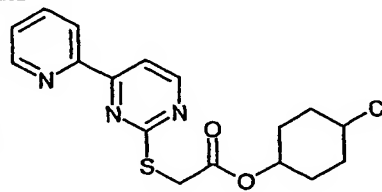
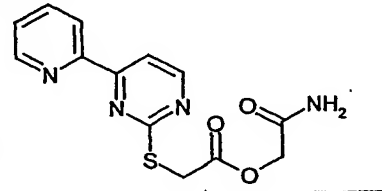
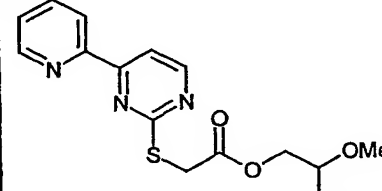
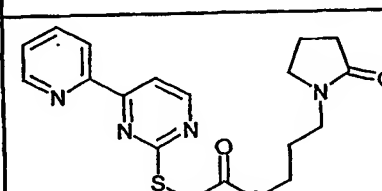
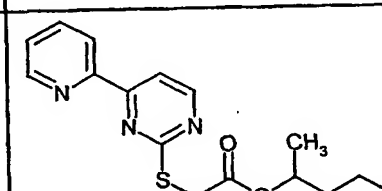
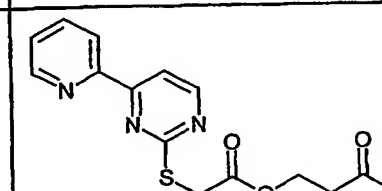
| Nr. | Struktur   | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|--|-------------------|--------|
| 126 |     | 2.29              |        |
| 127 |     | 1.76              |        |
| 128 |     | 2.50              |        |
| 129 |   | 2.51              |        |
| 130 |   | 3.51              |        |
| 131 |  | 3.45              |        |
| 132 |  |                   |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 133 |    | 3.06              |        |
| 134 |    | 0.43              | 184    |
| 135 |    | 2.23              | 220    |
| 136 |   | 0.44              | 195    |
| 137 |  | 3.22              |        |
| 138 |  | 2.92              |        |

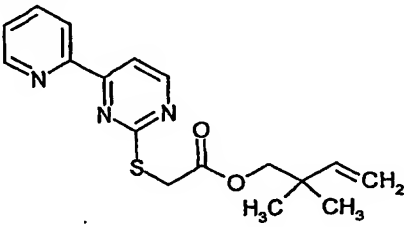
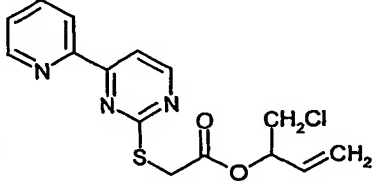
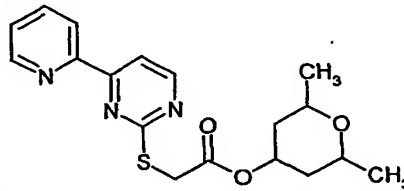
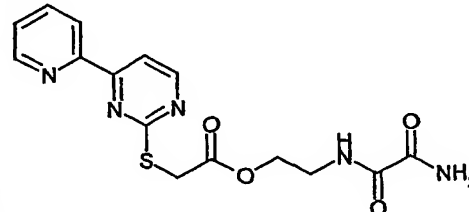
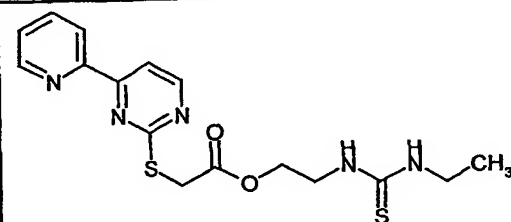
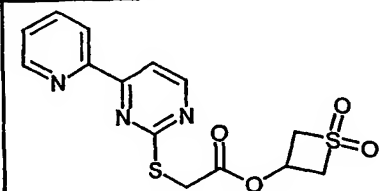
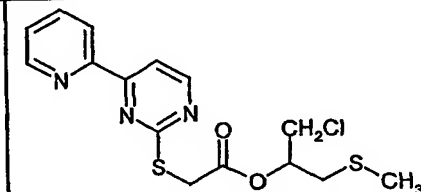
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 139 |    | 3.20              |        |
| 140 |    | 1.13              |        |
| 141 |    | 2.63              |        |
| 142 |   | 2.79              |        |
| 143 |  |                   |        |
| 144 |  |                   |        |
| 145 |  |                   |        |

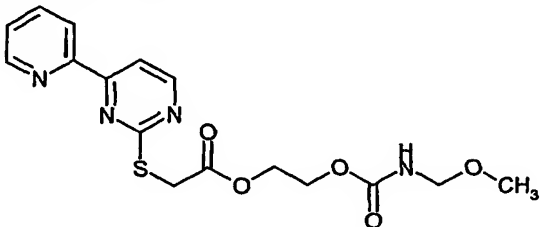
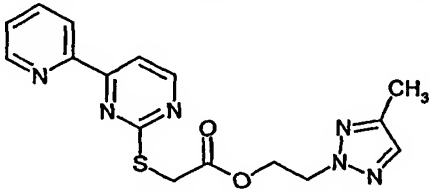
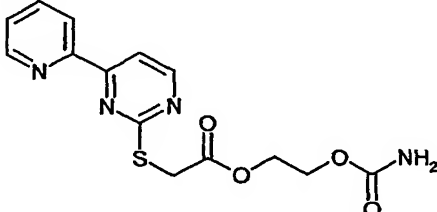
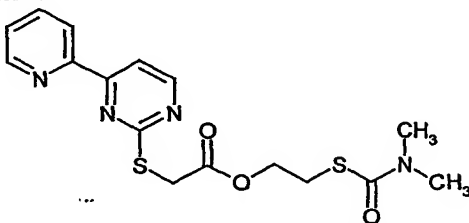
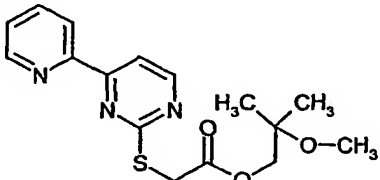
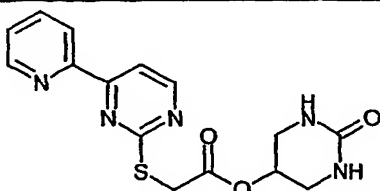
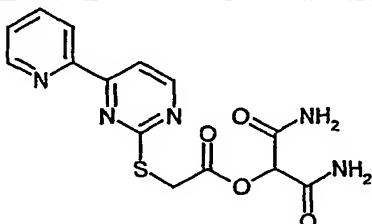
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 146 |    | 2.3               |        |
| 147 |    | 3.04              |        |
| 148 |    | 3.35              |        |
| 149 |   | 3.01              |        |
| 150 |  | 4.95              |        |
| 151 |  | 2.94              |        |
| 152 |  | 2.45              |        |
| 153 |  | 3.2               |        |

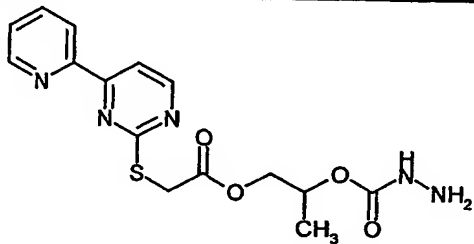
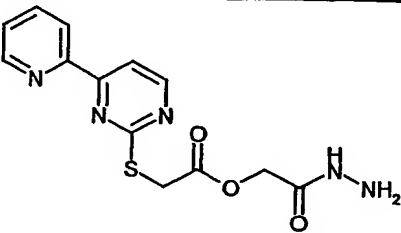
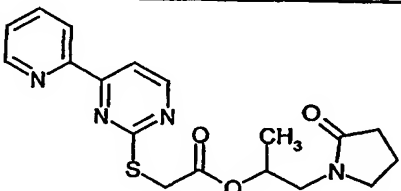
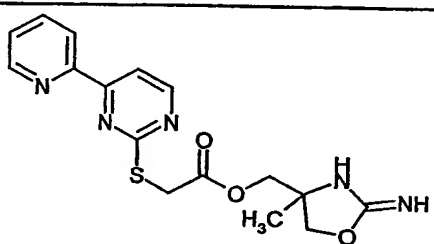
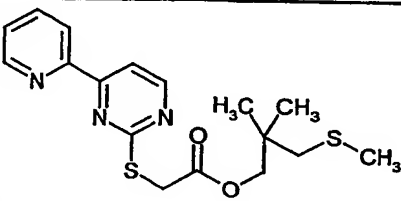
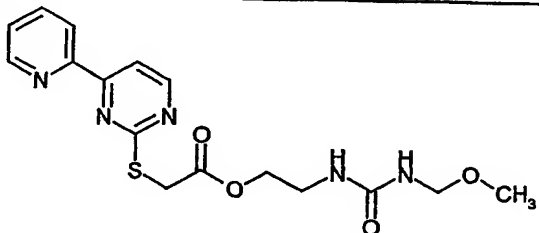
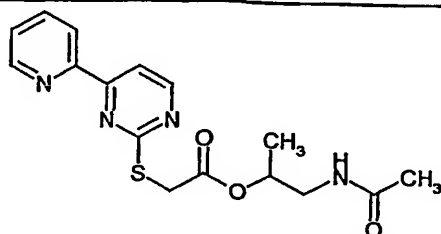
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 154 |    | 3.60              |        |
| 155 |    |                   |        |
| 156 |    |                   |        |
| 157 |   |                   |        |
| 158 |  | 1.98              |        |
| 159 |  | 4.00              |        |
| 160 |  | 1.59              |        |

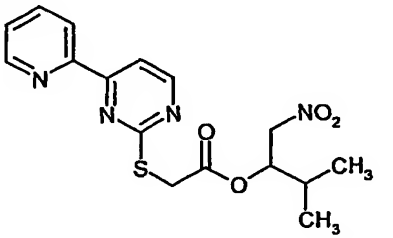
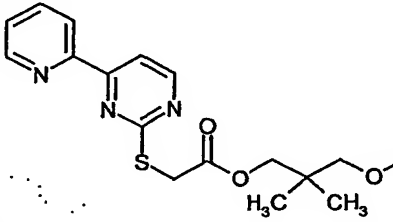
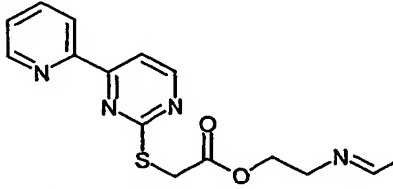
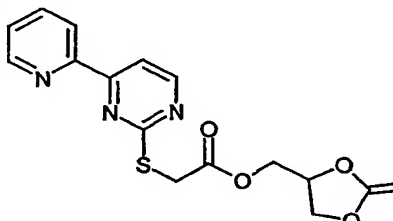
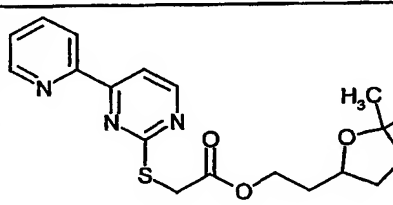
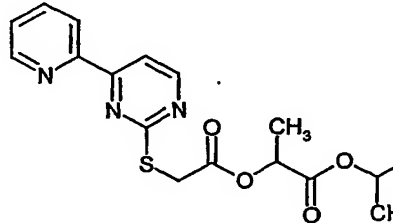
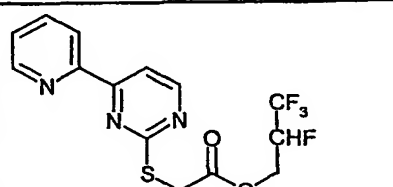
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 161 |    | 1.16              |        |
| 162 |    |                   |        |
| 163 |    | 1.11              |        |
| 164 |   | 2.05              |        |
| 165 |  | 1.64              |        |
| 166 |  |                   |        |
| 167 |  |                   |        |

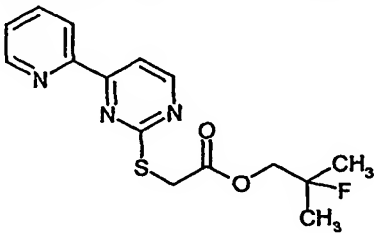
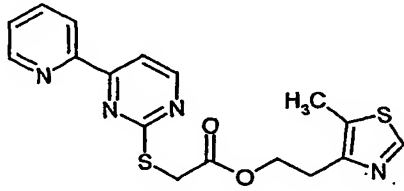
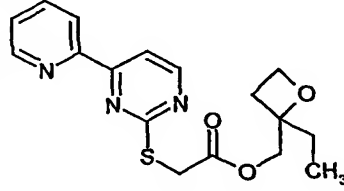
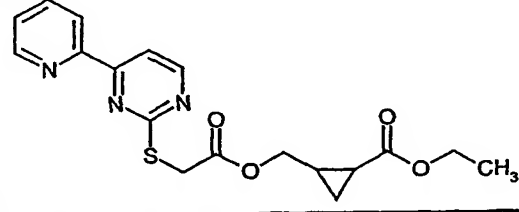
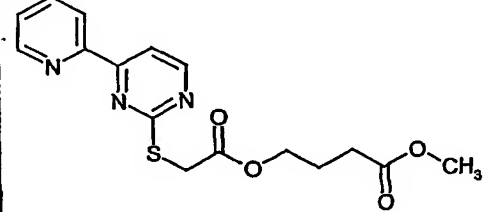
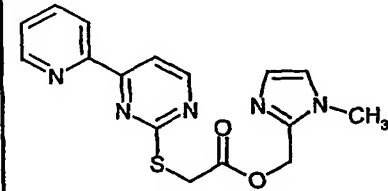
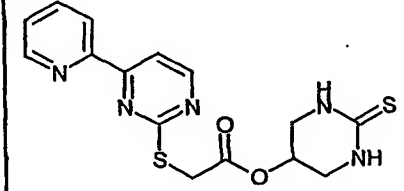


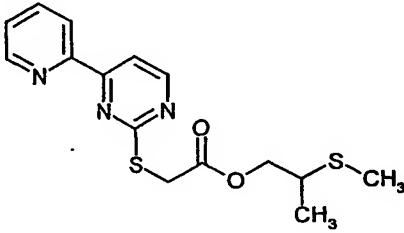
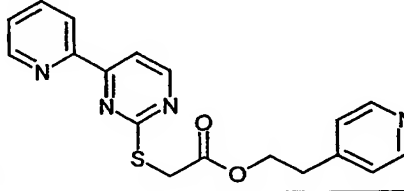
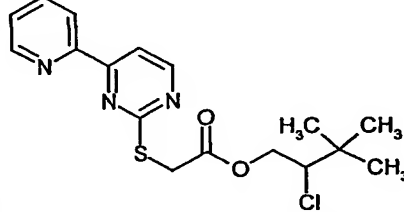
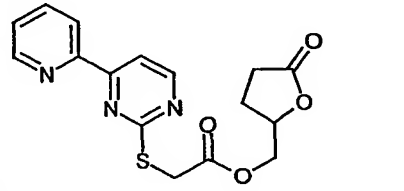
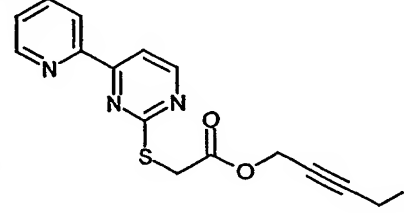
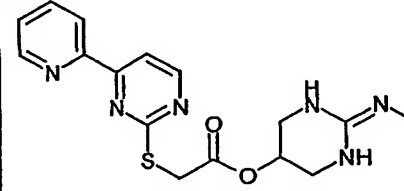
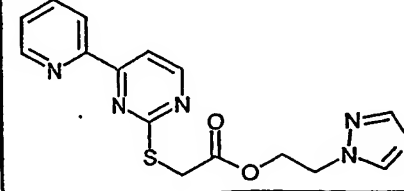
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 168 |    | 3.48              |        |
| 169 |    |                   |        |
| 170 |    |                   |        |
| 171 |   |                   |        |
| 172 |  | 1.79              |        |
| 173 |  | 1.67              |        |
| 174 |  |                   |        |

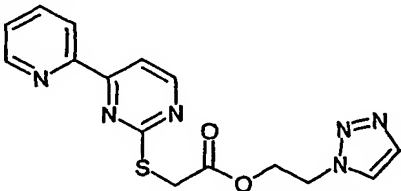
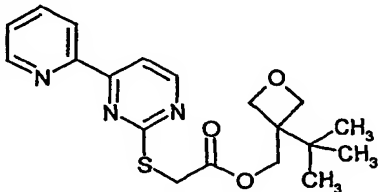
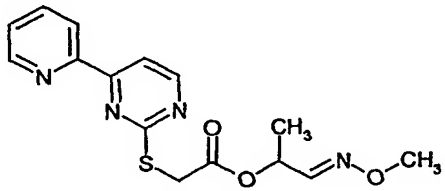
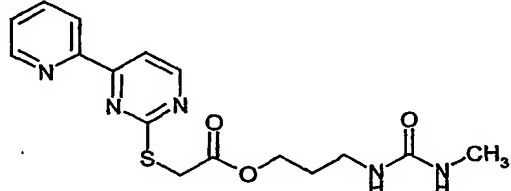
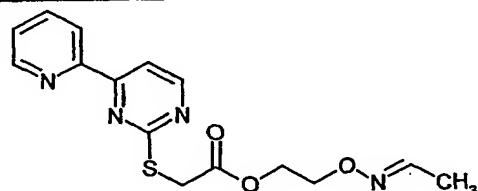
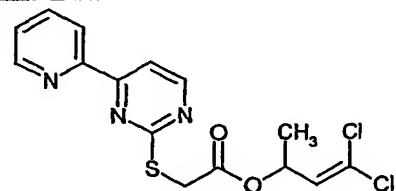
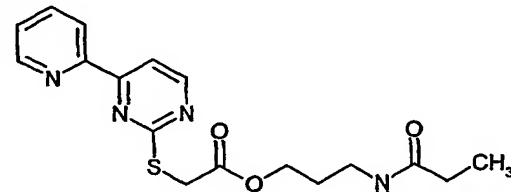
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 175 |    | 1.64              |        |
| 176 |    | 1.93              |        |
| 177 |    | 1.41              |        |
| 178 |   | 2.20              |        |
| 179 |  | 2.29              |        |
| 180 |  |                   |        |
| 181 |  |                   |        |

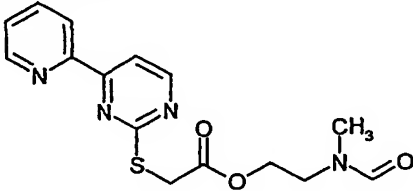
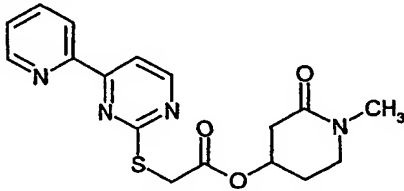
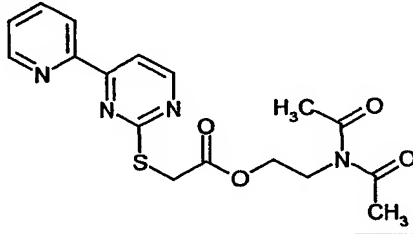
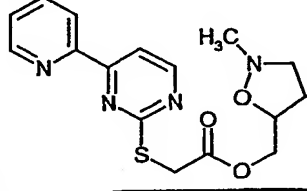
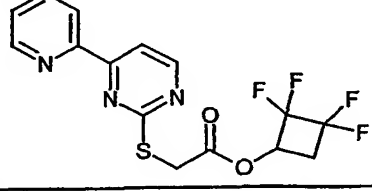
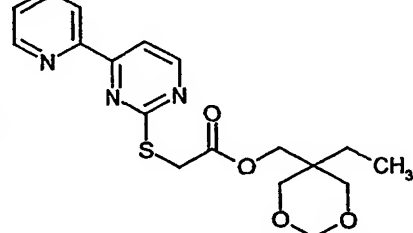
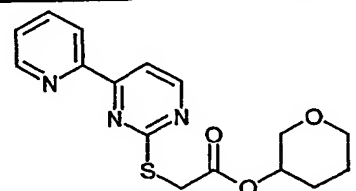
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 182 |    |                   |        |
| 183 |    |                   |        |
| 184 |    |                   |        |
| 185 |  |                   |        |
| 186 |  | 3.46              |        |
| 187 |  |                   |        |
| 188 |  | 1.97              |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 189 |    |                   |        |
| 190 |    | 3.05              |        |
| 191 |    | 2.02              |        |
| 192 |   | 1.63              |        |
| 193 |  | 2.46              |        |
| 194 |  | 2.95              |        |
| 195 |  | 2.72              |        |

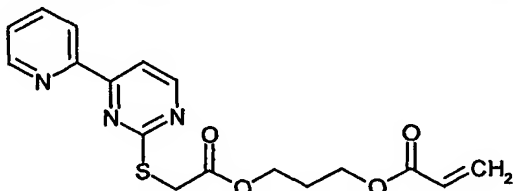
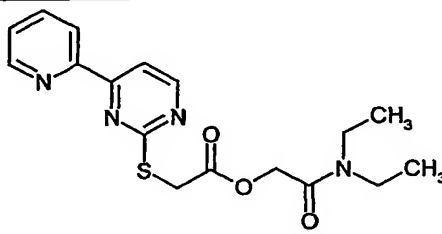
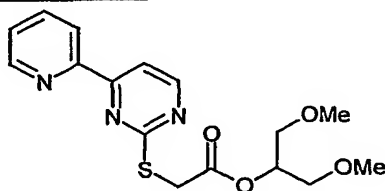
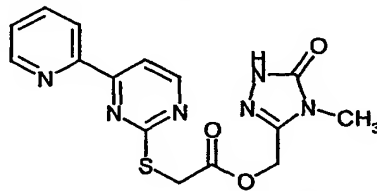
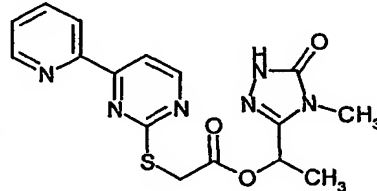
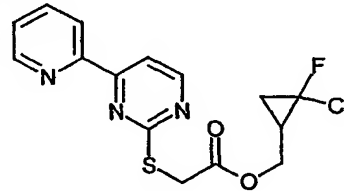
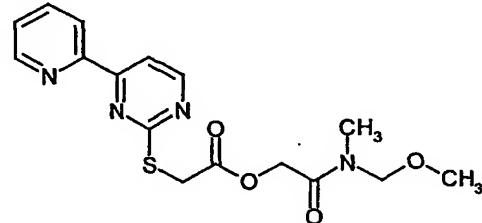
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 196 |    | 2.66              |        |
| 197 |    | 1.79              |        |
| 198 |    | 2.20              |        |
| 199 |   | 2.64              |        |
| 200 |  | 2.21              |        |
| 201 |  | 1.02              |        |
| 202 |  |                   |        |

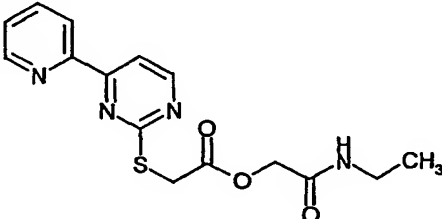
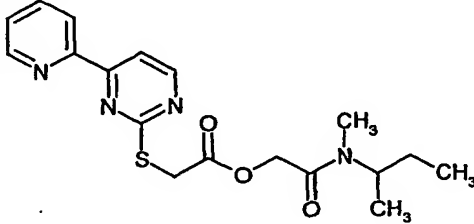
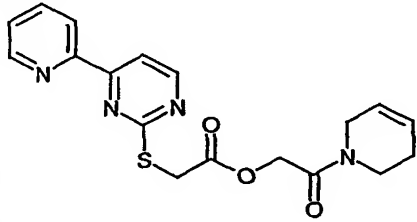
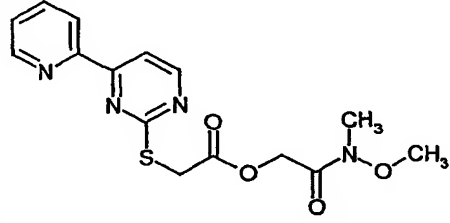
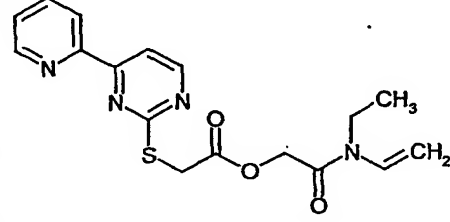
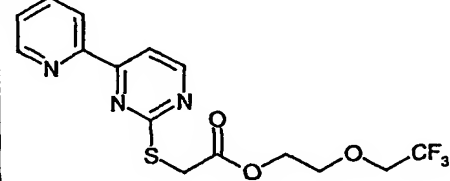
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 203 |    | 2.78              |        |
| 204 |    | 1.20              |        |
| 205 |   | 3.81              |        |
| 206 |  | 1.64              |        |
| 207 |  | 2.61              |        |
| 208 |  |                   |        |
| 209 |  | 1.32              |        |

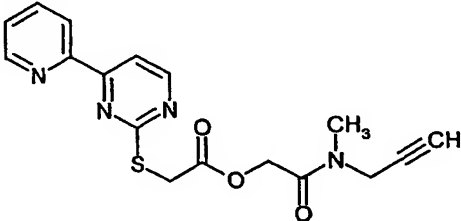
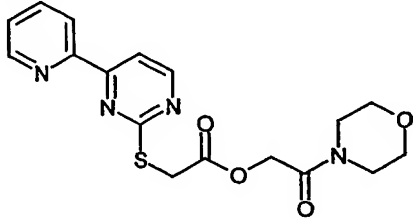
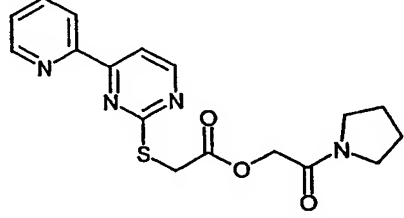
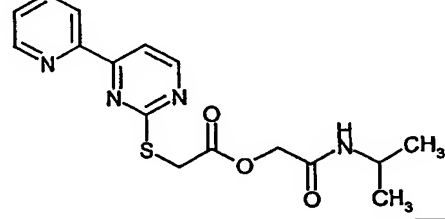
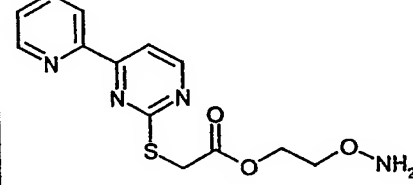
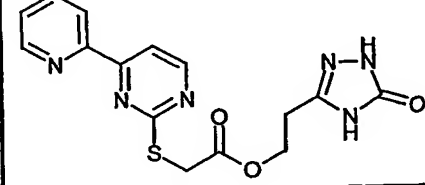
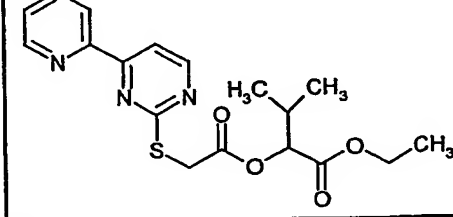
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 210 |    | 1.42              |        |
| 211 |    | 2.75              |        |
| 212 |    | 2.13              |        |
| 213 |   | 1.42              |        |
| 214 |  | 2.13              |        |
| 215 |  | 3.48              |        |
| 216 |  | 2.04              |        |

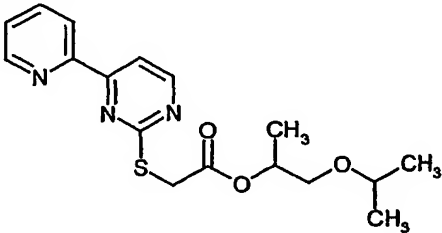
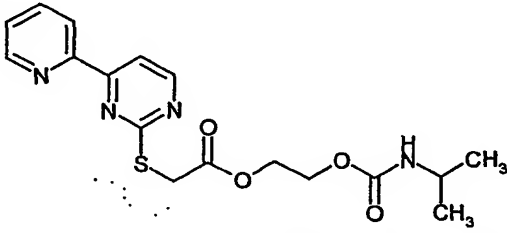
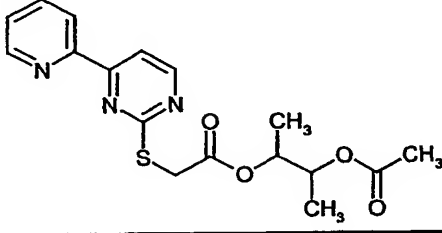
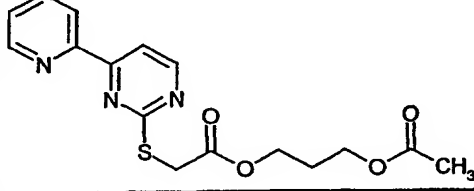
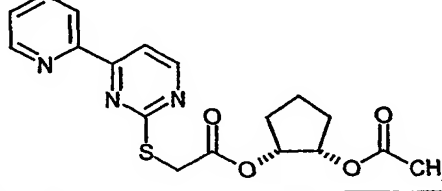
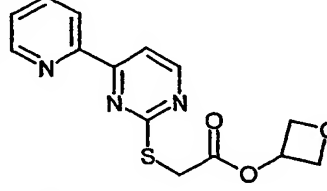
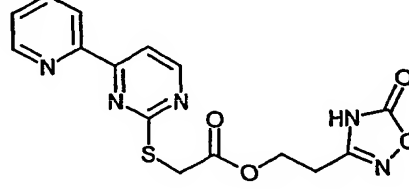
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 217 |    | 1.40              |        |
| 218 |    |                   |        |
| 219 |    |                   |        |
| 220 |   | 1.12              |        |
| 221 |  | 3.00              |        |
| 222 |  | 2.51              |        |
| 223 |  |                   |        |

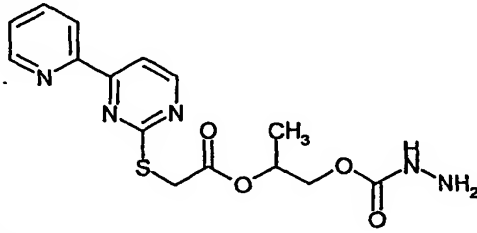
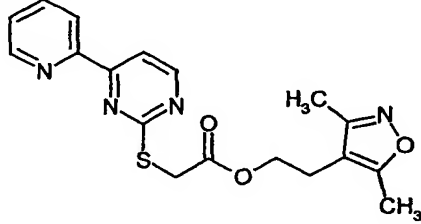
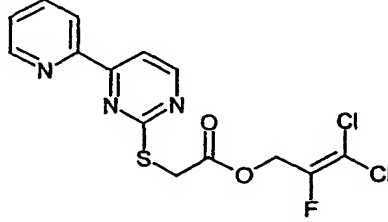
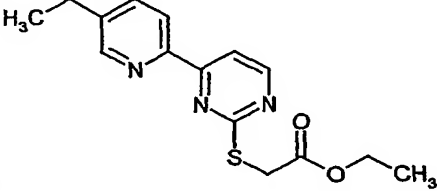
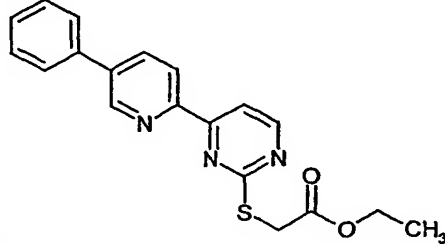
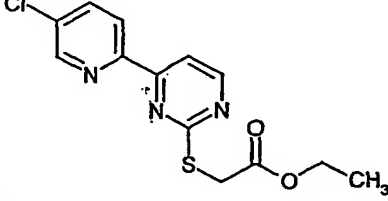
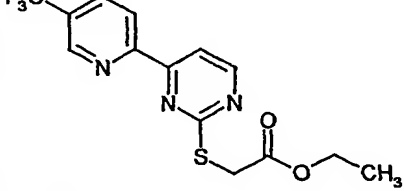


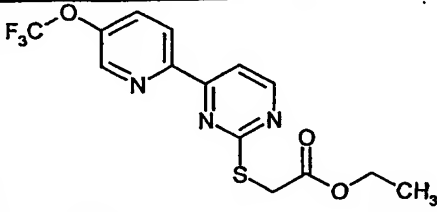
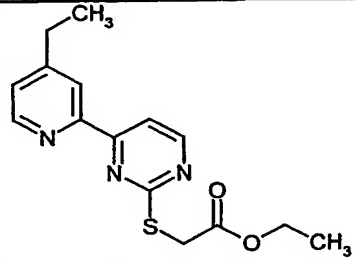
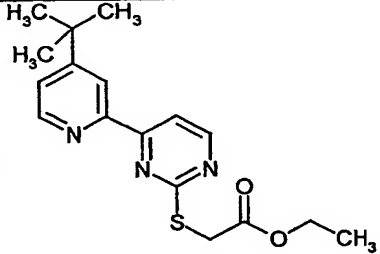
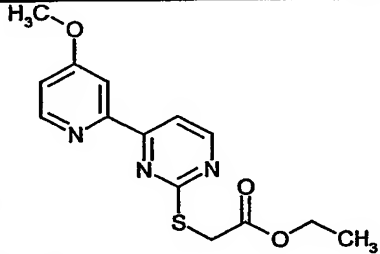
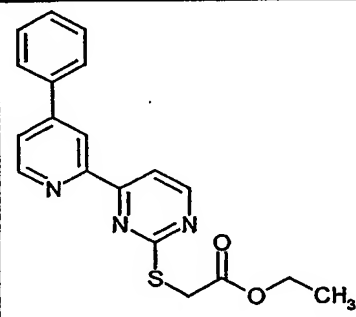
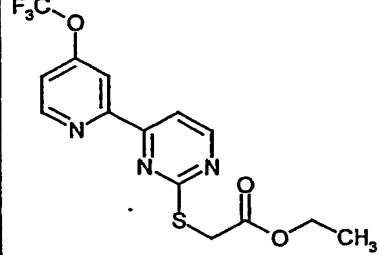
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 224 |    | 2.49              |        |
| 225 |    |                   |        |
| 226 |    |                   |        |
| 227 |   |                   |        |
| 228 |  |                   |        |
| 229 |  |                   |        |
| 230 |  | 1.96              |        |

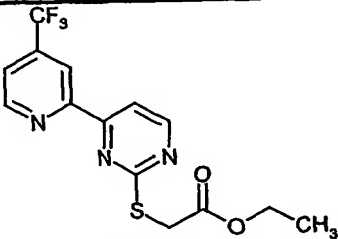
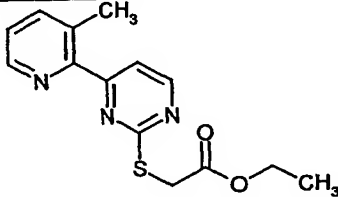
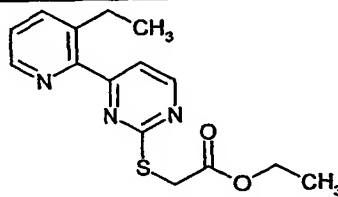
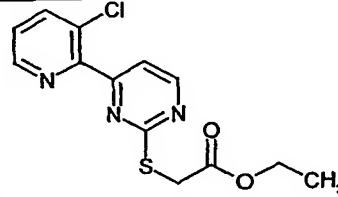
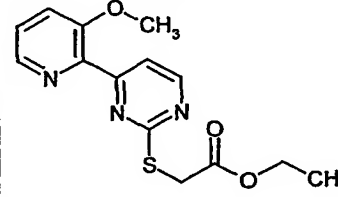
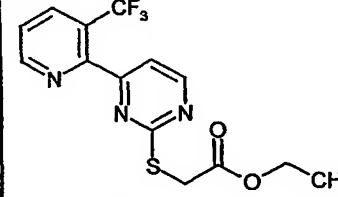
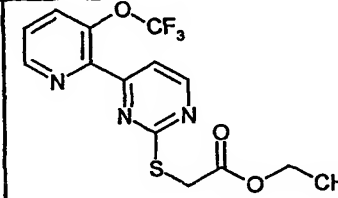
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 231 |    | 1.97              |        |
| 232 |    |                   |        |
| 233 |   |                   |        |
| 234 |  | 1.97              |        |
| 235 |  |                   |        |
| 236 |  | 2.70              |        |

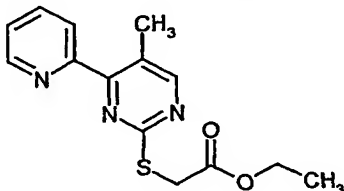
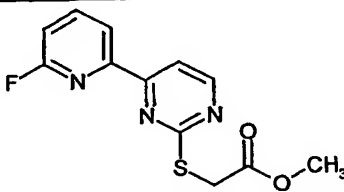
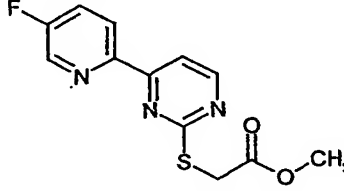
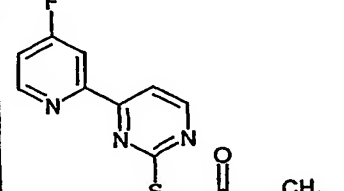
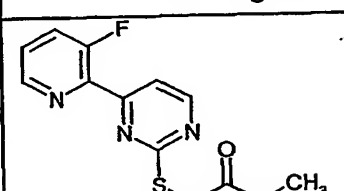
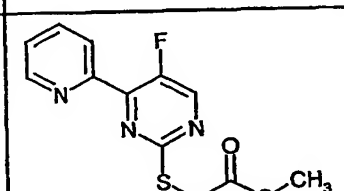
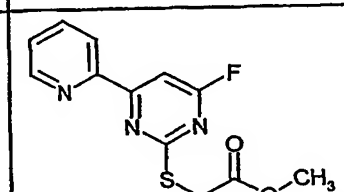
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 237 |    |                   |        |
| 238 |    |                   |        |
| 239 |   |                   |        |
| 240 |  |                   |        |
| 241 |  |                   |        |
| 242 |  |                   |        |
| 243 |  | 3.20              |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 244 |    |                   |        |
| 245 |    | 2.19              |        |
| 246 |   | 2.54              |        |
| 247 |  |                   |        |
| 248 |  | 2.65              |        |
| 249 |  | 1.69              |        |
| 250 |  | 1.97              |        |

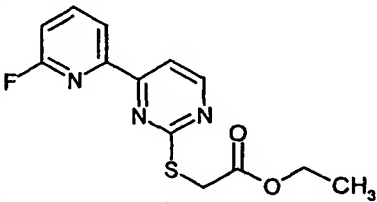
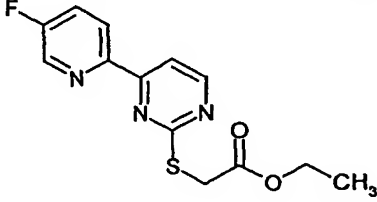
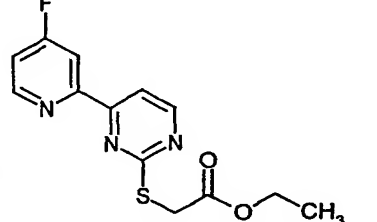
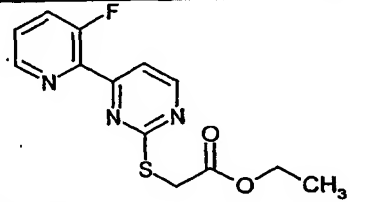
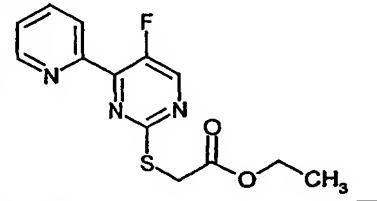
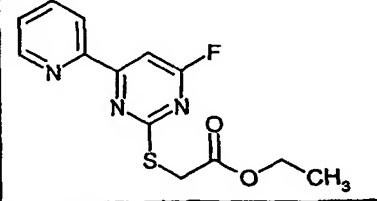
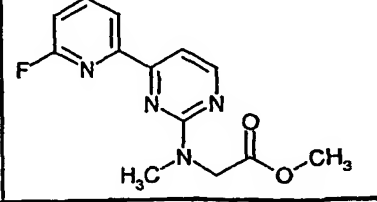
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 251 |    |                   |        |
| 252 |    | 2.25              |        |
| 253 |   | 3.19              |        |
| 254 |  | 2.98              |        |
| 255 |  |                   |        |
| 256 |  | 3.23              |        |
| 257 |  | 3.48              |        |

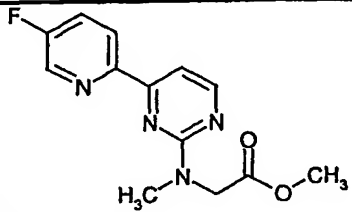
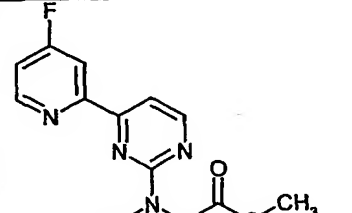
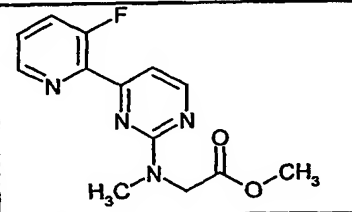
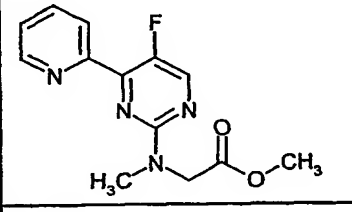
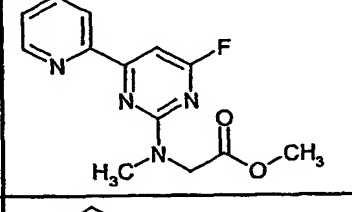
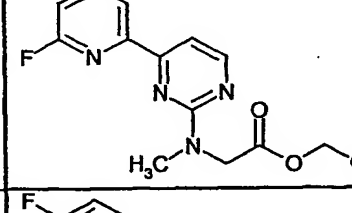
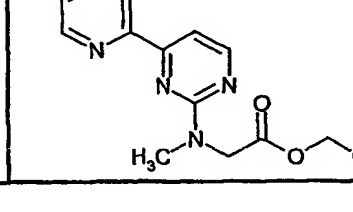
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 258 |    |                   |        |
| 259 |    | 2.69              |        |
| 260 |   |                   |        |
| 261 |  | 1.62              |        |
| 262 |  | 3.54              |        |
| 263 |  |                   |        |

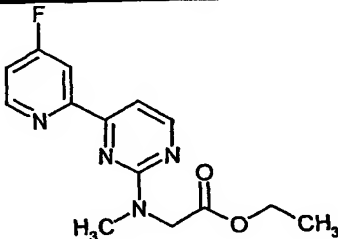
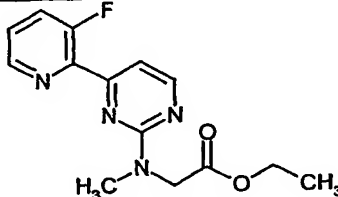
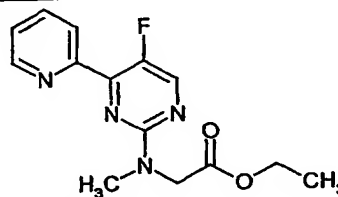
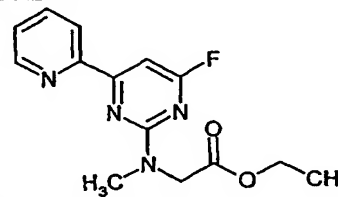
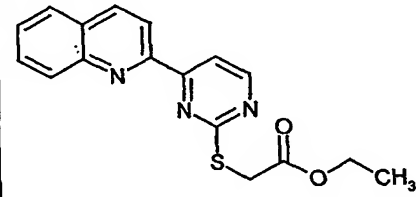
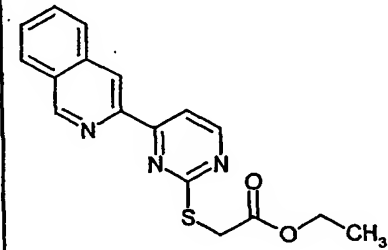
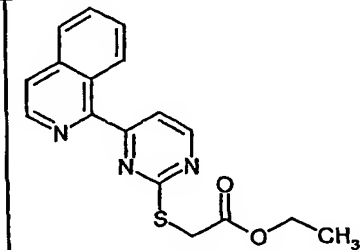
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 264 |    |                   |        |
| 265 |    | 1.85              |        |
| 266 |    | 2.22              |        |
| 267 |   |                   |        |
| 268 |  | 1.34              |        |
| 269 |  | 2.53              |        |
| 270 |  |                   |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 271 |    | 2.18              | 64-65  |
| 272 |    |                   |        |
| 273 |    |                   |        |
| 274 |   |                   |        |
| 275 |  |                   |        |
| 276 |  |                   |        |
| 277 |  |                   |        |

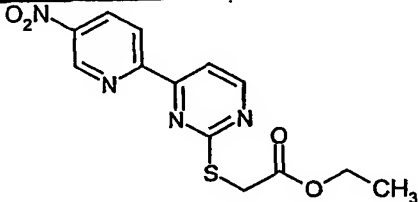
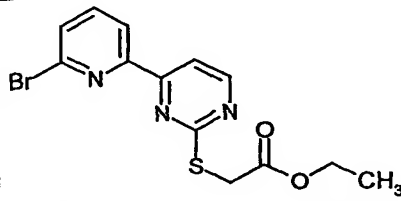
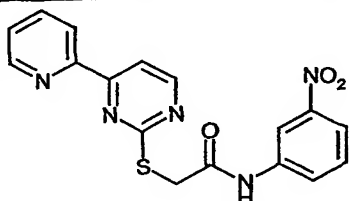
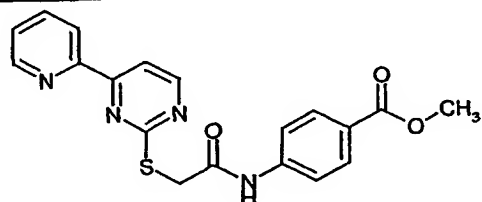
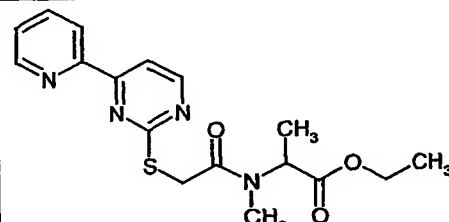
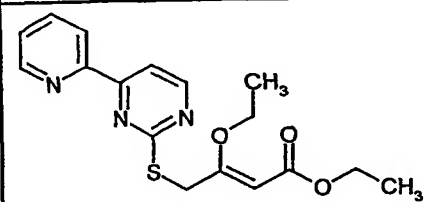
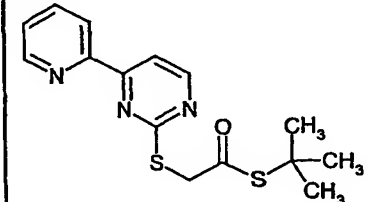


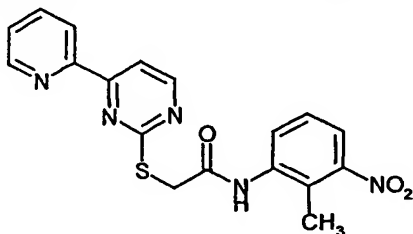
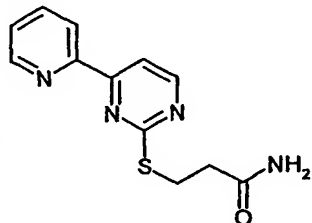
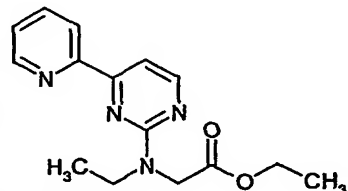
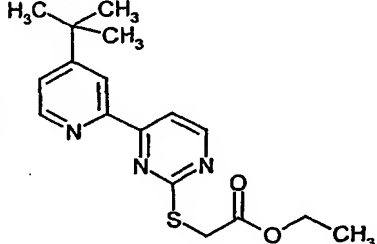
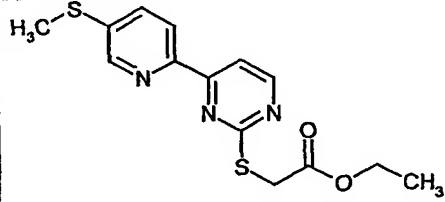
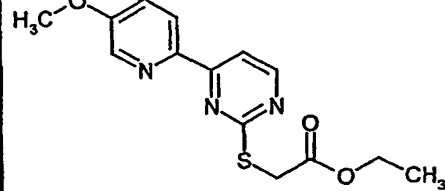
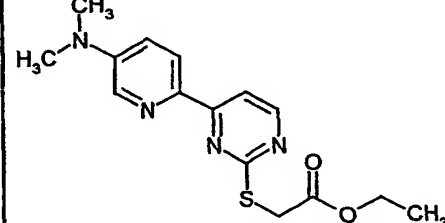
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 278 |    |                   |        |
| 279 |    |                   |        |
| 280 |    |                   |        |
| 281 |   | 2.04              |        |
| 282 |  |                   |        |
| 283 |  |                   |        |
| 284 |  |                   |        |

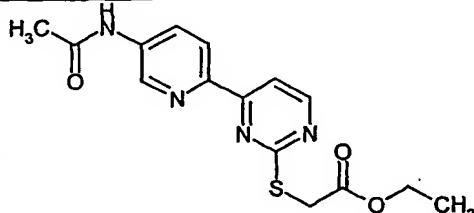
| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 285 |    |                   |        |
| 286 |    |                   |        |
| 287 |    |                   |        |
| 288 |   |                   |        |
| 289 |  |                   |        |
| 290 |  |                   |        |
| 291 |  |                   |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 292 |    |                   |        |
| 293 |    |                   |        |
| 294 |    |                   |        |
| 295 |   |                   |        |
| 296 |  | 3.49              |        |
| 297 |  |                   |        |
| 298 |  | 2.51              |        |

| Nr. | Struktur | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|----------|-------------------|--------|
| 299 |          | 1.17              | 162    |
| 300 |          | 1.59              |        |
| 301 |          | 1.24              |        |
| 302 |          | 2.69              |        |
| 303 |          | 2.57              |        |
| 304 |          | 5.37              |        |
| 305 |          | 3.39              |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 306 |    | 2.77              |        |
| 307 |    | 3.31              |        |
| 308 |    | 2.25              |        |
| 309 |   | 2.16              |        |
| 310 |  | 1.93              |        |
| 311 |  | 3.39              |        |
| 312 |  | 3.61              |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 313 |    | 2.28              |        |
| 314 |    | 0.96              |        |
| 315 |    | 2.13              |        |
| 316 |  | 3.55              |        |
| 317 |  | 1.68              |        |
| 318 |  |                   |        |
| 319 |  |                   |        |

| Nr. | Struktur  | Log P<br>(pH 2.3) | Fp./°C |
|-----|---|-------------------|--------|
| 320 |  |                   |        |

5 Die Bestimmung der angegebenen logP-Werte erfolgte gemäß EEC-Directive 79/831 Annex V.A8 durch HPLC (High Performance Liquid Chromatography) an einer Phasenumkehrsäule (C 18). Temperatur: 43°C.

Eluenten für die Bestimmung im sauren Bereich: 0,1 % wässrige Phosphorsäure, Acetonitril; linearer Gradient von 10 % Acetonitril bis 90 % Acetonitril.

10

Die Eichung erfolgte mit unverzweigten Alkan-2-onen (mit 3 bis 16 Kohlenstoffatomen), deren logP-Werte bekannt sind (Bestimmung der logP-Werte anhand der Retentionszeiten durch lineare Interpolation zwischen zwei aufeinanderfolgenden Alkanonen).

15

Die lambda-max-Werte wurden an Hand der UV-Spektren von 200 nm bis 400 nm in den Maxima der chromatographischen Signale ermittelt.

### Anwendungsbeispiele

#### Beispiel A

##### 5      **Aphis gossypii-Test**

Lösungsmittel:      30    Gewichtsteile    Dimethylformamid

Emulgator:            1    Gewichtsteil    Alkylarylpolyglykoether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15      Baumwollblätter (*Gossypium hirsutum*), die stark von der Baumwollblattlaus (*Aphis gossypii*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

20      Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

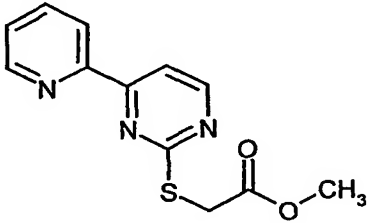
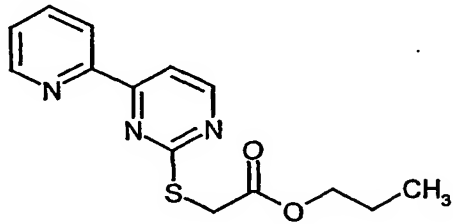
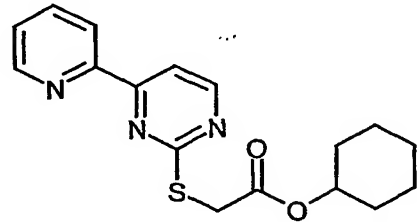
25



- 164 -

Tabelle A  
pflanzenschädigende Insekten  
**Aphis gossypii-Test**

5

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 6 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
| <br><chem>COC(=O)CSc1nc2ccccc2n1</chem>            | 200                                  | 85  |
| <br><chem>CCOC(=O)CSc1nc2ccccc2n1</chem>          | 200                                  | 85  |
| <br><chem>C1CCC(CC1)OC(=O)CSc1nc2ccccc2n1</chem> | 200                                  | 90  |

Beispiel B**Franklinella-Test**

- 5      Lösungsmittel:      3    Gewichtsteile    Dimethylformamid  
Emulgator:            1    Gewichtsteil     Alkylarylpolyglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1  
Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator  
und verdünnt das Konzentrat auf die gewünschte Konzentration.

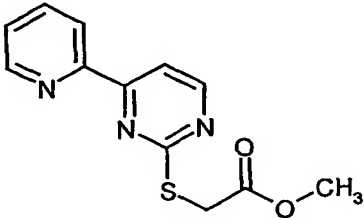
15      Gurkenpflanzen (*Cucumis sativus*), die stark von allen Stadien der Thripse (*Franklinella occidentalis*) befallen sind, werden mit einer Wirkstoffzubereitung der  
gewünschten Konzentration gespritzt.

Nach der gewünschten Zeit wird die Wirkung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Thripse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Thripse abgetötet wurden.

20      Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden  
Tabelle hervor.

- 166 -

Tabelle B  
pflanzenschädigende Insekten  
**Franklinella-Test**

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 7 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
| <br><chem>COC(=O)CS1=NC2=CC=CC=C2N=C1N2</chem> | 1000                                 | 99  |

Beispiel C**Meloidogyne-Test**

- 5      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

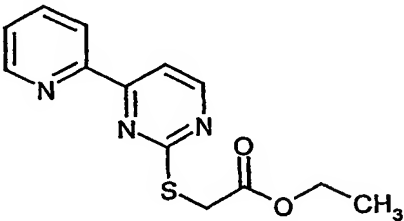
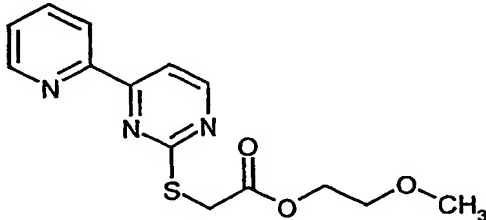
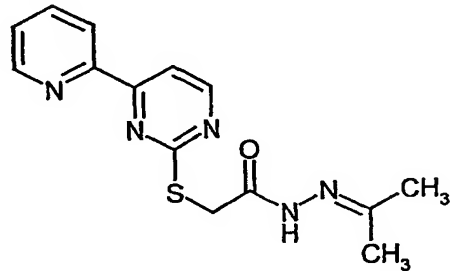
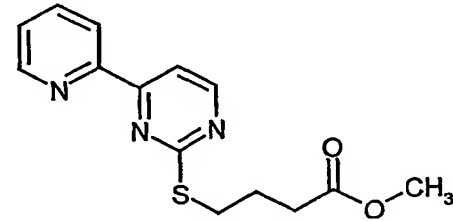
- 10      Gefäße werden mit Sand, Wirkstofflösung, Meloidogyne incognita-Ei-Larvensuspension und Salatsamen gefüllt. Die Salatsamen keimen und die Pflänzchen entwickeln sich. An den Wurzeln entwickeln sich die Gallen.

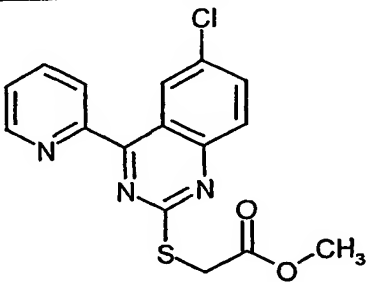
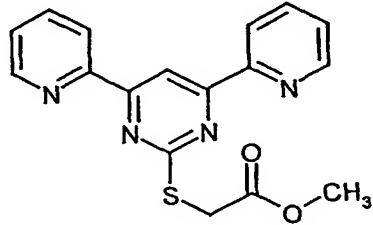
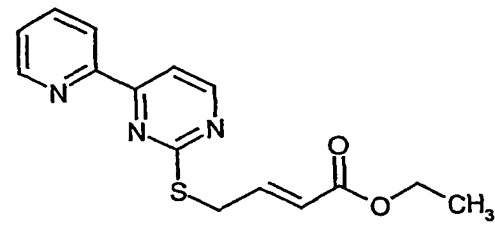
- 15      Nach der gewünschten Zeit wird die nematizide Wirkung an Hand der Gallenbildung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass keine Gallen gefunden wurden; 0 % bedeutet, dass die Zahl der Gallen an den behandelten Pflanzen der der unbehandelten Kontrolle entspricht.

- 20      Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

Tabelle C-1  
pflanzenschädigende Nematoden  
**Meloidogyne -Test**

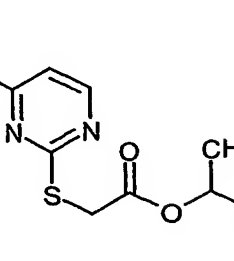
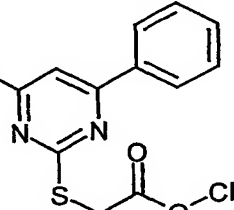
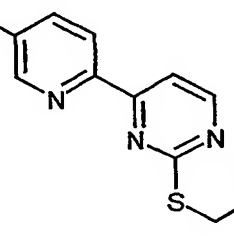
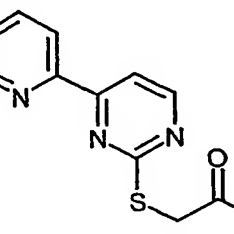
5      Lösungsmittel:      30    Gewichtsteile    Dimethylformamid  
      Emulgator:        1    Gewichtsteil     Alkylarylpolyglykolether

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 14 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|--|
|    | 20                                   | 90   |
|   | 20                                   | 90   |
|  | 20                                   | 98   |
|  | 20                                   | 90   |

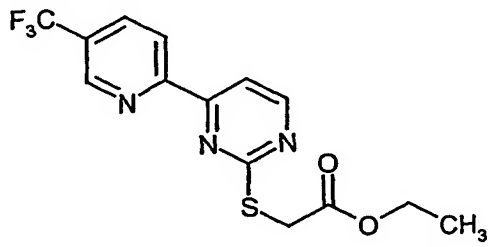
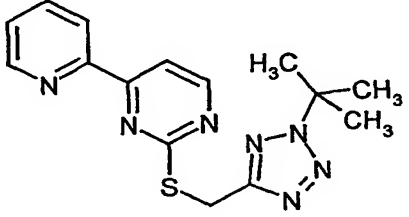
| Wirkstoffe   | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 14 <sup>d</sup> |
|--|--------------------------------------|--|
| <br><chem>CCOC(=O)CS1=NC2=C(N1)C(=C(C=C2)Cl)C3=CC=CC=N3</chem>          | 20                                   | 98   |
| <br><chem>CCOC(=O)CS1=NC2=C(N1)C(=C(C=C2)C3=CC=CC=N3)C4=CC=CC=N4</chem> | 20                                   | 95   |
| <br><chem>CCOC(=O)/C=C/CS1=NC2=C(N1)C=CC=C2C3=CC=CC=N3</chem>          | 20                                   | 100  |

**Tabelle C-2**  
**pflanzenschädigende Nematoden**  
**Meloidogyne -Test**

|   |                |   |               |                         |
|---|----------------|---|---------------|-------------------------|
|   | Lösungsmittel: | 7 | Gewichtsteile | Dimethylformamid        |
| 5 | Emulgator:     | 2 | Gewichtsteil  | Alkylarylpolglykolether |

| Wirkstoffe  | Wirkstoffkonzentration in ppm | Abtötungsgrad in % nach 14 <sup>d</sup> |
|---|-------------------------------|---|
|    | 20                            | 80                                      |
|  | 20                            | 100                                     |
|  | 20                            | 90                                      |
|  | 20                            | 90                                      |

- 171 -

| Wirkstoffe   | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 14 <sup>d</sup> |
|--|--------------------------------------|--|
| <br><chem>CCOC(=O)CS1=NC2=CC=CC=C2N1c1ccc(C(F)(F)F)cn1</chem> | 20                                   | 100  |
| <br><chem>CC1(C)CN2C(=NN1)SC2c1ccn(C1=CC=CC=C1)n1</chem>      | 20                                   | 90   |



Beispiel D**Myzus-Test**

5      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

10     Kohlblätter (*Brassica oleracea*), die stark von der Pfirsichblattlaus (*Myzus persicae*) befallen sind, werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt.

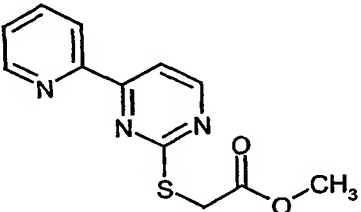
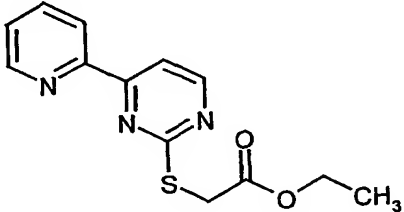
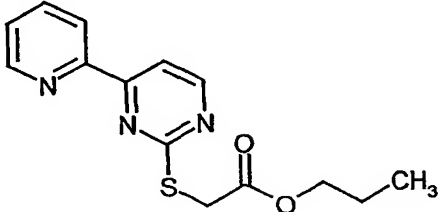
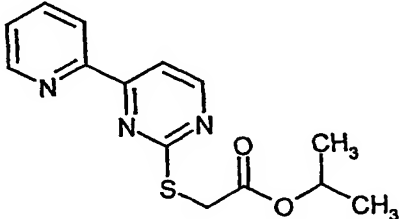
15     Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Blattläuse abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Blattläuse abgetötet wurden.

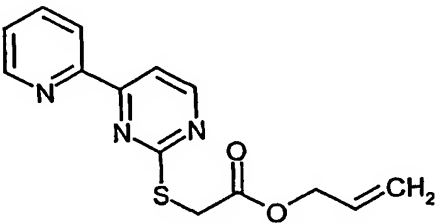
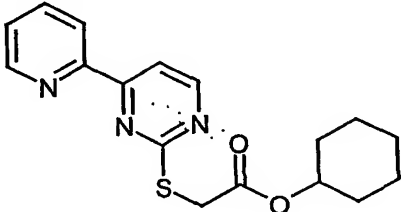
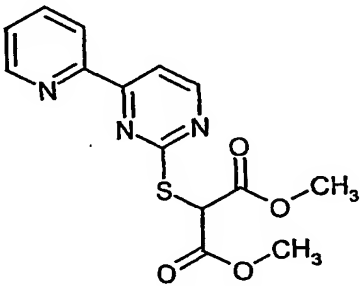
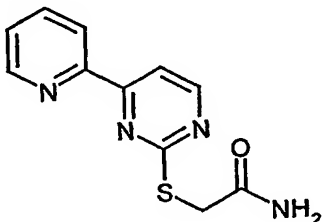
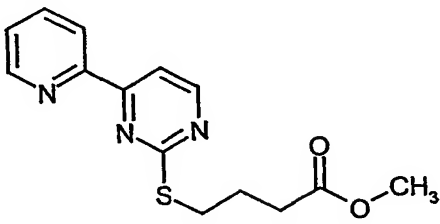
Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

20

Tabelle D-1  
pflanzenschädigende Insekten  
Myzus- Test

5 Lösungsmittel: 30 Gewichtsteile Dimethylformamid  
Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolglykolether

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 6 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
|    | 100                                  | 100                                       |
|   | 1000                                 | 100                                       |
|  | 1000                                 | 95  |
|  | 1000                                 | 100                                       |

| Wirkstoffe   | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 6 <sup>d</sup> |
|--|--------------------------------------|---|
| <br><chem>C=CCOC(=O)CSc1nc2ccncc2n1</chem>        | 1000                                 | 95  |
| <br><chem>C1CCC(CC1)OC(=O)CSc1nc2ccncc2n1</chem>  | 1000                                 | 100                                       |
| <br><chem>COC(=O)C(C(=O)OC)Sc1nc2ccncc2n1</chem> | 100                                  | 95  |
| <br><chem>NC(=O)CSc1nc2ccncc2n1</chem>          | 1000                                 | 95  |
| <br><chem>COC(=O)CCCCSc1nc2ccncc2n1</chem>      | 1000                                 | 100                                       |

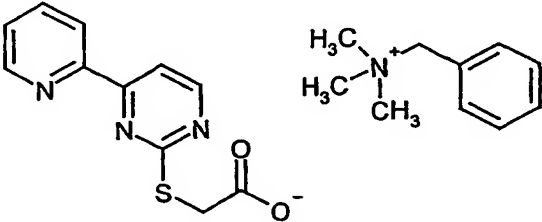
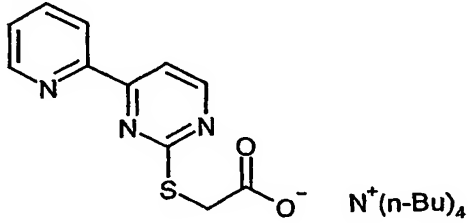
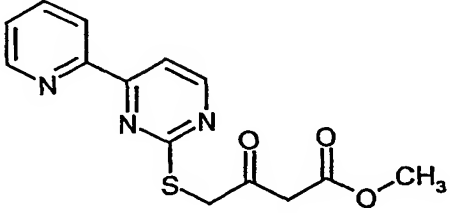
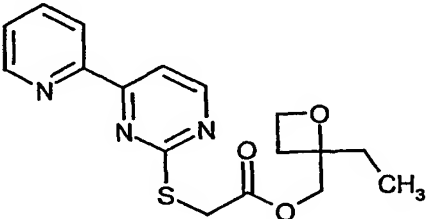
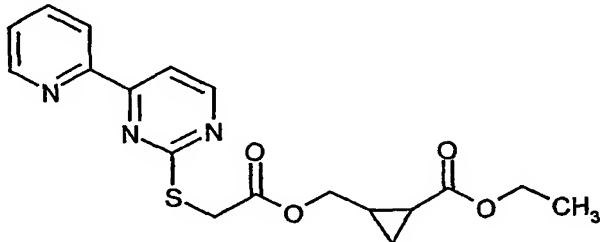
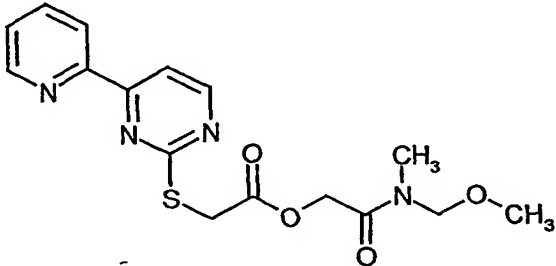
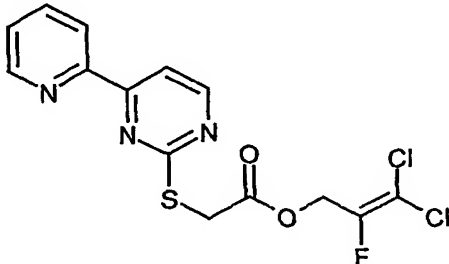
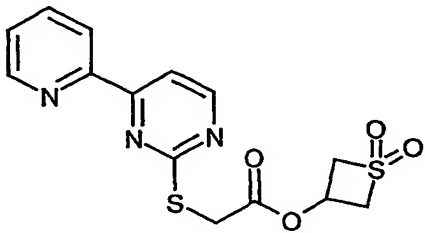
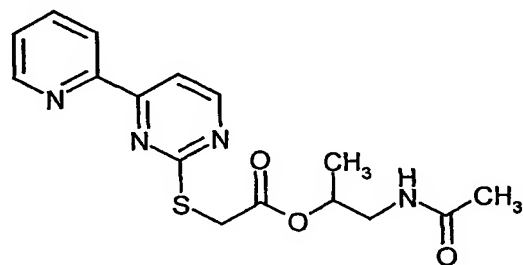
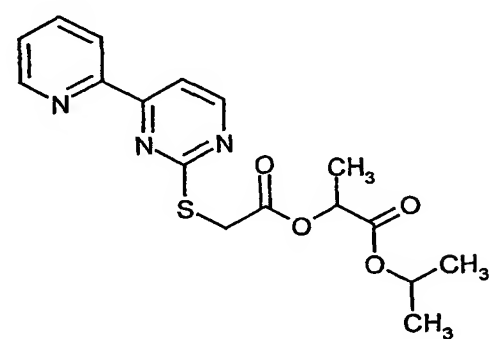
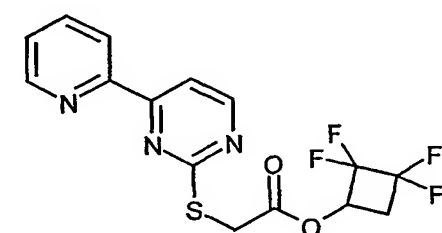
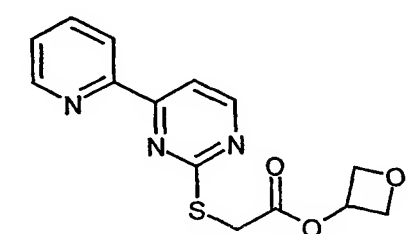
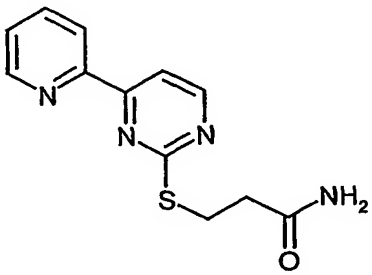
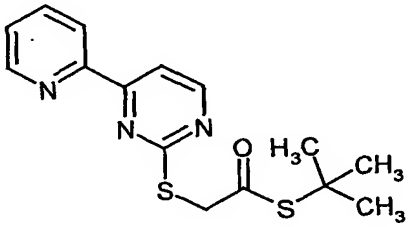
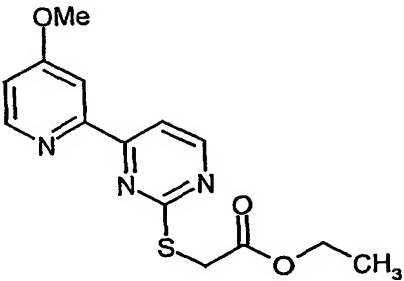
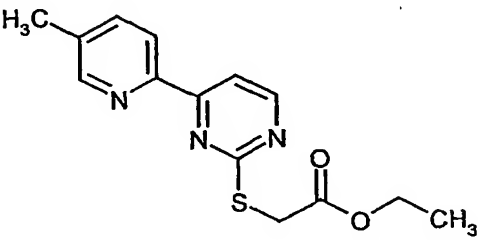
| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 6 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
| <br><chem>Cc1ccc(cc1)[N+](C)(C)C.[O-]C(=O)CSc2nc3ccccc3n2</chem> | 1000                                 | 100                                       |
| <br><chem>[O-]C(=O)CSc2nc3ccccc3n2.[n+](CCCC)CCCC</chem>         | 1000                                 | 100                                       |
| <br><chem>COC(=O)CC(=O)CSc2nc3ccccc3n2</chem>                   | 200                                  | 95  |

Tabelle D-2  
pflanzenschädigende Insekten  
Myzus- Test

|   |                |   |               |                          |
|---|----------------|---|---------------|--------------------------|
|   | Lösungsmittel: | 7 | Gewichtsteile | Dimethylformamid         |
| 5 | Emulgator:     | 2 | Gewichtsteil  | Alkylarylpolyglykolether |

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 6 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
|    | 500                                  | 98  |
|   | 500                                  | 98  |
|  | 500                                  | 98  |
|  | 500                                  | 100                                       |

| Wirkstoffe  | Wirkstoffkonzentration in ppm | Abtötungsgrad in % nach 6 <sup>d</sup> |
|---|-------------------------------|--|
| <br><chem>Cc1cc2nc(cc2n1)SCC(=O)O[C@H]3CCS(=O)(=O)C3</chem>      | 500                           | 100                                    |
| <br><chem>Cc1cc2nc(cc2n1)SCC(=O)OC(C)CN(C)C=O</chem>             | 500                           | 95                                     |
| <br><chem>Cc1cc2nc(cc2n1)SCC(=O)OC(C)C(=O)OC(C)C</chem>         | 500                           | 95                                     |
| <br><chem>Cc1cc2nc(cc2n1)SCC(=O)OC3C(C(F)(F)F)C(F)(F)F3</chem> | 500                           | 100                                    |
| <br><chem>Cc1cc2nc(cc2n1)SCC(=O)OC3COC3</chem>                 | 500                           | 95                                     |

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 6 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
|    | 500                                  | 80  |
|    | 500                                  | 95  |
|   | 500                                  | 90  |
|  | 500                                  | 98  |

Beispiel E**Phaedon-Larven-Test**

- 5      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.
- 10     Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Larven des Meerrettichblattkäfers (*Phaedon cochleariae*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.
- 15     Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Käferlarven abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Käferlarven abgetötet wurden.

Lösungsmittelmenge und Emulgatormenge, Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus den folgenden Tabellen hervor.

20

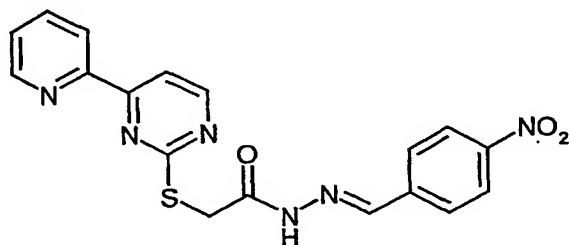


- 180 -

Tabelle E-1  
pflanzenschädigende Insekten  
**Phaedon-Larven-Test**

|                |    |               |                          |
|----------------|----|---------------|--------------------------|
| Lösungsmittel: | 30 | Gewichtsteile | Dimethylformamid         |
| 5 Emulgator:   | 1  | Gewichtsteil  | Alkylarylpolyglykolether |

| Wirkstoffe | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 7 <sup>d</sup> |
|------------|--------------------------------------|---|
|------------|--------------------------------------|---|

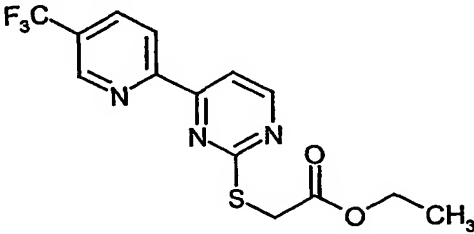
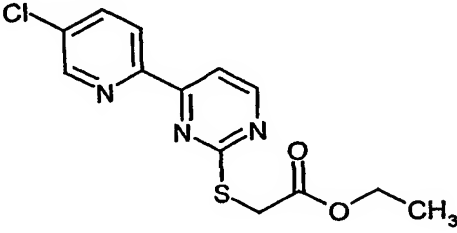
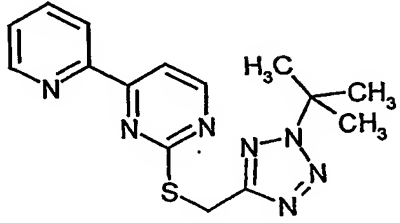


1000

100

Tabelle E-2  
pflanzenschädigende Insekten  
**Phaedon-Larven-Test**

5      Lösungsmittel:      7    Gewichtsteile    Dimethylformamid  
      Emulgator:      2    Gewichtsteil     Alkylarylpolglykolether

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 7 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
|  <chem>CCOC(=O)CSc1nc2cc(C3=CC=C(C=C3)C(F)(F)F)nc2n1</chem>      | 500                                  | 100                                       |
|  <chem>CCOC(=O)CSc1nc2cc(C3=CC=C(C=C3)Cl)nc2n1</chem>           | 500                                  | 100                                       |
|  <chem>CC1(C)CN2C(=N1)N=CN2CSc3nc4cc(C5=CC=CC=C5N)nc4n3</chem> | 500                                  | 100                                       |

Beispiel F**Spodoptera frugiperda-Test**

- 5      Lösungsmittel:      7      Gewichtsteile Dimethylformamid  
Emulgator:      2      Gewichtsteile Alkylarylpolglykolether

10      Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit den angegebenen Mengen Lösungsmittel und Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit emulgatorhaltigem Wasser auf die gewünschte Konzentration.

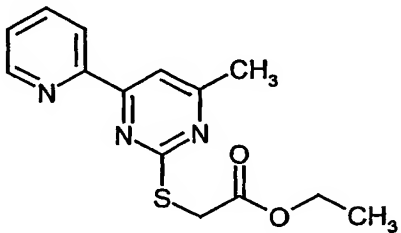
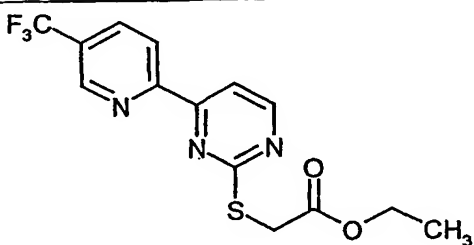
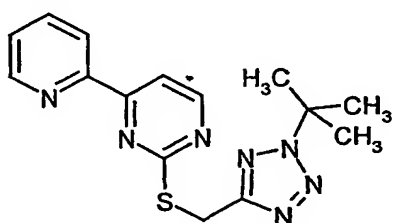
15      Kohlblätter (*Brassica oleracea*) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit Raupen des Heerwurms (*Spodoptera frugiperda*) besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

20      Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

Wirkstoffe, Wirkstoffkonzentration und Versuchsergebnisse gehen aus der folgenden Tabelle hervor.

- 183 -

Tabelle F  
pflanzenschädigende Insekten  
**Spodoptera frugiperda -Test**

| Wirkstoffe  | Wirkstoff<br>konzentration<br>in ppm | Abtötungsgrad<br>in % nach 7 <sup>d</sup> |
|---|--------------------------------------|---|
|    | 500                                  | 100                                       |
|   | 500                                  | 100                                       |
|  | 500                                  | 100                                       |

Beispiel G**Diabrotica balteata – Test (Larven im Boden)**

Grenzkonzentrations-Test / Bodeninsekten - Behandlung transgener Pflanzen

5

Lösungsmittel: 7 Gewichtsteile Dimethylformamid

Emulgator: 1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykoether

10

Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel, gibt die angegebene Menge Emulgator zu und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

15

Die Wirkstoffzubereitung wird auf den Boden gegossen. Dabei spielt die Konzentration des Wirkstoffs in der Zubereitung praktisch keine Rolle, entscheidend ist allein die Wirkstoffgewichtsmenge pro Volumeneinheit Boden, welche in ppm (mg/l) angegeben wird. Man füllt den Boden in 0,25 l Töpfe und lässt diese bei 20°C stehen.

20

Sofort nach dem Ansatz werden je Topf 5 vorgekeimte Maiskörner der Sorte YIELD GUARD (Warenzeichen von Monsanto Comp., USA) gelegt. Nach 2 Tagen werden in den behandelten Boden die entsprechenden Testinsekten gesetzt. Nach weiteren 7 Tagen wird der Wirkungsgrad des Wirkstoffs durch Auszählen der aufgelaufenen Maispflanzen bestimmt (1 Pflanze = 20% Wirkung).

Beispiel H**Heliothis virescens - Test (Behandlung transgener Pflanzen)**

- 5      Lösungsmittel:      7 Gewichtsteile Dimethylformamid  
Emulgator:              1 Gewichtsteil Alkylarylpolyglykolether

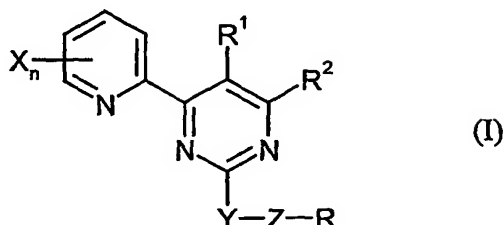
Zur Herstellung einer zweckmäßigen Wirkstoffzubereitung vermischt man 1 Gewichtsteil Wirkstoff mit der angegebenen Menge Lösungsmittel und der angegebenen Menge Emulgator und verdünnt das Konzentrat mit Wasser auf die gewünschte Konzentration.

Sojatriebe (Glycine max) der Sorte Roundup Ready (Warenzeichen der Monsanto Comp. USA) werden durch Tauchen in die Wirkstoffzubereitung der gewünschten Konzentration behandelt und mit der Tabakknospenraupe *Heliothis virescens* besetzt, solange die Blätter noch feucht sind.

Nach der gewünschten Zeit wird die Abtötung in % bestimmt. Dabei bedeutet 100 %, dass alle Raupen abgetötet wurden; 0 % bedeutet, dass keine Raupen abgetötet wurden.

Patentansprüche

## 1. Pyridylpyrimidine der Formel (I)



in welcher

$R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy,  $-S(O)_pR^3$ ,  $-NR^4R^5$ ,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-CSR^6$ ,  $-CONR^4R^5$ ,  $-NHCO_2R^8$ , Cycloalkyl; oder für gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel stehen,

$R^1$  und  $R^2$  außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 bis 3 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls durch Halogen oder Alkyl substituiert sein kann,

X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkenyl, Alkynyl, Alkenyloxy, Halogenalkenyloxy, Alkinyloxy, Halogenalkinyloxy,  $-S(O)_pR^3$ ,  $-NR^4R^5$ ,  $-COR^6$ ,  $-CO_2R^7$ ,  $-CSR^6$ ,  $-CONR^4R^5$ ,  $-NHCO_2R^8$ , Cycloalkyl, Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Hetero-

cyclyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht;

5 oder wenn n für 2, 3 oder 4 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Alkylen oder Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome aus der Reihe Stickstoff und Sauerstoff unterbrochen sein kann,

10 n für 0, 1, 2, 3 oder 4 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2, 3 oder 4 steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff,  $-S(O)_p-$  oder  $-NR^9-$  steht,

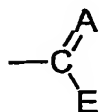
15 p für 0, 1 oder 2 steht,

Z für  $-(CH_2)_r-$ ,  $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ ,  $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$  oder  $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$  steht,

20 r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,

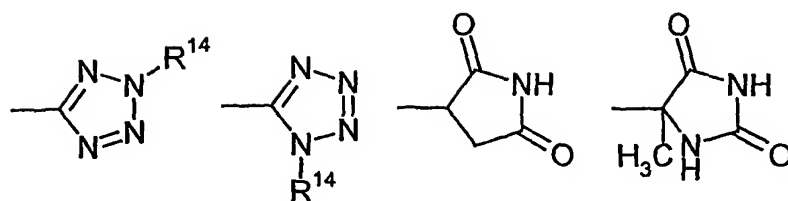
t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

25 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe





steht,

5

A für Sauerstoff, Schwefel oder  $\text{NR}^{15}$  steht,

E für  $-\text{OR}^{16}$ ,  $-\text{SR}^{16}$ ,  $-\text{O-M}$ ,  $-\text{S-M}$  oder  $-\text{NR}^{17}\text{R}^{18}$  steht,

10

M für gegebenenfalls durch Alkyl, Aryl oder Arylalkyl substituiertes Ammonium oder für ein Alkalimetallion steht,

M außerdem für ein Erdalkalimetallion steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,

15

$\text{R}^3$  für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

20

$\text{R}^4$  für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl oder Alkylcarbonyl steht,

25

$\text{R}^5$  für Wasserstoff, Amino, Formyl, Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Alkoxy, Alkoxyalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxy-carbonyl, Oxamoyl steht,

$\text{R}^4$  und  $\text{R}^5$  außerdem gemeinsam für Alkyliden; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Nitro, Alkyl, Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen;

5           R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann,

          R<sup>6</sup>   für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl oder Arylalkyl steht,

10          R<sup>7</sup>   für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl oder Arylalkyl steht,

          R<sup>8</sup>   für Alkyl oder Halogenalkyl steht,

15          R<sup>9</sup>   für Wasserstoff, Alkyl, Halogenalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Arylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht,

20

          R<sup>10</sup> für Halogen, Alkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl; oder für Aryl oder Arylalkyl, welche ihrerseits im Arylteil durch Halogen oder Alkyl substituiert sein können, steht,

25          R<sup>11</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,

          R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, Alkyl oder Alkoxy stehen,

30          R<sup>14</sup> für Wasserstoff, Alkyl oder Halogenalkyl steht,

- 5  
10  
15  
20  
25  
30
- R<sup>15</sup> für Wasserstoff, Alkyl, Alkoxy, Cyano oder Dialkylamino steht,
- R<sup>16</sup> für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxyalkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> oder für einen der Reste Q steht,
- R<sup>16</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- R<sup>17</sup> für Wasserstoff oder Alkyl steht,
- R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht,

R<sup>18</sup> außerdem für jeweils gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxycarbonyl, Alkenyloxycarbonyl substituiertes Alkyl oder Alkenyl steht,

5

R<sup>18</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,

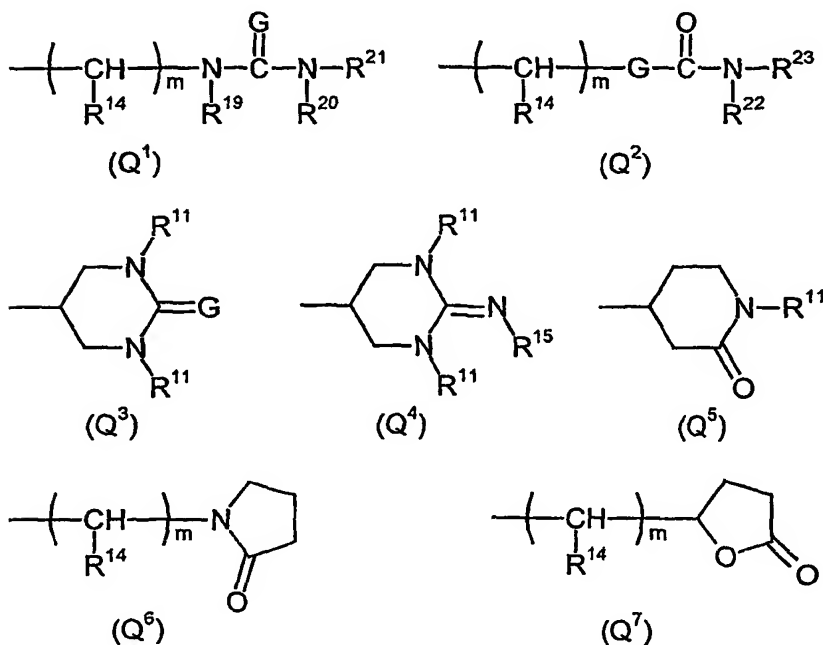
10

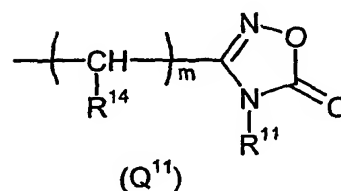
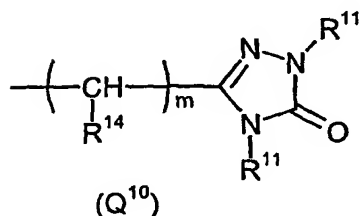
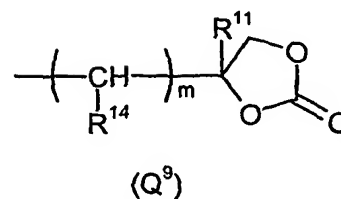
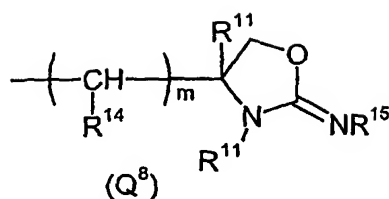
R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 bis 2 weitere Heteroatome aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel enthalten kann und der gegebenenfalls durch Alkyl substituiert sein kann, stehen,

15

Q für eine der folgenden Gruppierungen

20





steht, wobei die Reste  $R^{11}$  die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen,

$m$  für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit  $-(CHR^{14})-$  innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn  $m$  für 2 oder 3 steht,

$G$  für Sauerstoff oder Schwefel steht,

$R^{19}$  und  $R^{20}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Alkyl oder gemeinsam für Alkylen stehen,

$R^{21}$  für Wasserstoff, für gegebenenfalls durch Alkylcarbonyloxy oder Alkoxy substituiertes Alkyl; oder für gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Alkyl, Halogenalkyl, Alkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl, Alkylen substituiertes Aryl steht,

$R^{22}$  für Wasserstoff, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht,

$R^{23}$  für Wasserstoff, Amino, Alkyl oder Alkoxyalkyl steht.

2. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

5  $R^{16}$  für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkenyloxy-carbonyl, Alkylcarbonyloxy, Alkenylcarbonyloxy, Oxyalkylenoxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy,  $-\text{CONR}^4\text{R}^5$ ,  $-\text{NR}^4\text{R}^5$ ,  $-\text{ONR}^4\text{R}^5$ ,  $-\text{C}(\text{R}^{14})=\text{N}-\text{OR}^{14}$  substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Alkoxy-carbonyl, Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Arylalkyl, Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für  $-\text{NR}^4\text{R}^5$  oder für einen der Reste Q steht,

15

$R^{18}$  für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Alkyl, Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls durch Halogen, Hydroxy, Alkyl, Halogenalkyl, Alkoxy, Halogenalkoxy, Alkylthio, Halogenalkylthio, Oxyalkylenoxy substituiertes Cycloalkyl, Cycloalkylalkyl, Aryl, Arylalkyl, Heteroaryl oder Heteroarylalkyl mit 1 bis 4 Heteroatomen aus der Reihe Stickstoff, Sauerstoff und Schwefel; oder für  $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^3$ ,  $-\text{OR}^{14}$  oder  $-\text{NR}^4\text{R}^5$  steht.

20

3. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

25

$R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -Alkyl,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -Halogenalkyl,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -Alkoxy,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -Halogenalkoxy,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -Alkylthio,  $\text{C}_1$ - $\text{C}_6$ -Halogenalkylthio,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -Alkenyl,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -Alkynyl,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -Alkenyloxy,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -Halogenalkenyloxy,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -Alkinyloxy,  $\text{C}_2$ - $\text{C}_6$ -Halogenalkinyloxy,  $-\text{S}(\text{O})_p\text{R}^3$ ,  $-\text{NR}^4\text{R}^5$ ,  $-\text{COR}^6$ ,  $-\text{CO}_2\text{R}^7$ ,  $-\text{CSR}^6$ ,  $-\text{CONR}^4\text{R}^5$ ,  $-\text{NHCO}_2\text{R}^8$ ,  $\text{C}_3$ - $\text{C}_7$ -Cycloalkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden

30

durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl oder 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, stehen,

R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> außerdem gemeinsam für C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylen oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl substituiert sein kann,

X für Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyloxy, -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -COR<sup>6</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -CSR<sup>6</sup>, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NHCO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, steht;

oder wenn n für 2 oder 3 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylen oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylen stehen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann,

n für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 oder 3 steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff,  $-S(O)_p-$  oder  $-NR^9-$  steht,

p für 0, 1 oder 2 steht,

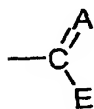
5 Z für  $-(CH_2)_r-$ ,  $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ ,  $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ ,  
 $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$   
oder  $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$  steht,

r für 1, 2, 3, 4, 5 oder 6 steht,

10

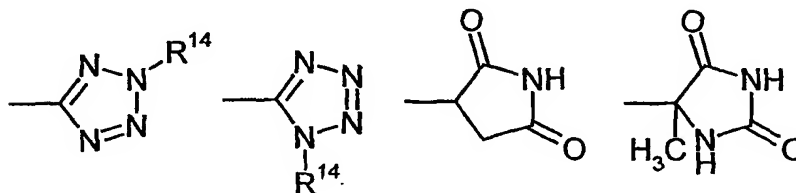
t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

R für die Gruppierung



15

oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus  
der Gruppe



20

steht,

A für Sauerstoff, Schwefel oder  $NR^{15}$  steht,

E für  $-OR^{16}$ ,  $-SR^{16}$ ,  $-O-M$ ,  $-S-M$  oder  $-NR^{17}R^{18}$  steht,

25

M für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch  
 $C_1-C_6$ -Alkyl, Aryl oder Aryl- $C_1-C_6$ -alkyl substituiertes Ammonium



oder für ein Lithiumkation ( $\text{Li}^+$ ), ein Natriumkation ( $\text{Na}^+$ ) oder ein Kaliumkation ( $\text{K}^+$ ) steht,

5 M außerdem für ein Magnesiumkation ( $\text{Mg}^{2+}$ ) oder ein Calciumkation ( $\text{Ca}^{2+}$ ) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,

10 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4  
15 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,

20 R<sup>4</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl steht,

25 R<sup>5</sup> für Wasserstoff, Amino, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-carbonyl, Oxamoyl steht,

30 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl substituiertes Benzyliden stehen,

R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder

ungesättigten Heterocylus stehen, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl substituiert sein kann,

5

R<sup>6</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht,

10

R<sup>7</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht,

R<sup>8</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht,

15

R<sup>9</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,

20

25

R<sup>10</sup> für Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl substituiert sein können, steht,

30

R<sup>11</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht,

R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy stehen,

R<sup>14</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl steht,

5

R<sup>15</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, Cyano oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino steht,

10

R<sup>16</sup> für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryl-oxy, Halogenaryloxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> oder für einen der Reste Q steht,

20

25

30

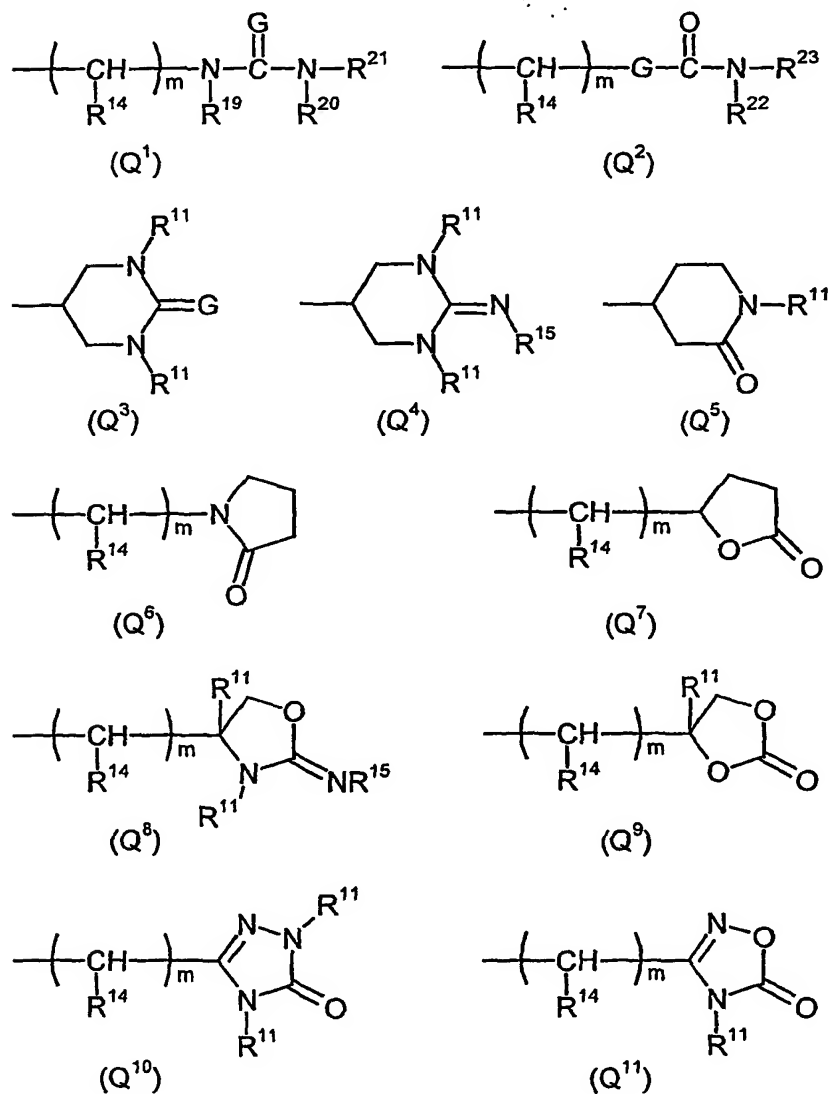
R<sup>16</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte

Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,

- 5           R<sup>17</sup>   für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl steht,
- 10           R<sup>18</sup>   für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylen)oxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht,
- 15           R<sup>18</sup>   außerdem für jeweils einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxycarbonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl steht,
- 20           R<sup>18</sup>   außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,
- 25           R<sup>18</sup>   außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,
- 30           R<sup>18</sup>   außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,

$R^{17}$  und  $R^{18}$  außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl substituiert sein kann, stehen,

Q für eine der folgenden Gruppierungen



steht, wobei die Reste  $R^{11}$  die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen,

- 5            m        für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit  $-(CHR^{14})$ - innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,
- 10           G        für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- $R^{19}$  und  $R^{20}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl oder gemeinsam für  $C_2$ - $C_4$ -Alkylen stehen,
- 15            $R^{21}$     für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyloxy oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy substituiertes  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Cyano,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_{10}$ -Alkoxycarbonyl,
- 20            $C_3$ - $C_5$ -Alkylen substituiertes Aryl steht,
- $R^{22}$     für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_6$ -alkyl steht,
- $R^{23}$     für Wasserstoff, Amino,  $C_1$ - $C_6$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_6$ -alkyl
- 25           steht.

4.    Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 3, in welcher

- 30            $R^{16}$     für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1$ - $C_6$ -Alkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Halogenalkylthio,  $C_1$ - $C_6$ -Alkoxycarbonyl,  $C_2$ - $C_6$ -Alkenyloxycar-

- bonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>16</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>10</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkynyl;
- 5 oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> oder für einen der Reste Q steht,
- 15 R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder mehrfach, gleich oder verschieden durch Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylen)oxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl welche jeweils 0 bis 4 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht.
- 20  
 25

5. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

- 30 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio,

5 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -COR<sup>6</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -CSR<sup>6</sup>, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NHCO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl; oder für  
10 jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, stehen,

15 R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> außerdem gemeinsam für C<sub>3</sub>-C<sub>5</sub>-Alkylen oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylen, wobei die Kohlenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann und der dadurch gebildete Ring wiederum gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann, stehen,

20 X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -COR<sup>6</sup>, -CO<sub>2</sub>R<sup>7</sup>, -CSR<sup>6</sup>, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NHCO<sub>2</sub>R<sup>8</sup>,  
25 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthält, steht,

30

oder wenn n für 2 steht, zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylen oder C<sub>3</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylen steht, wobei die Koh-



lenstoffkette durch 1 oder 2 Heteroatome, welche 0 bis 2 Stickstoffatome und/oder 0 oder 1 Sauerstoffatom sein können, unterbrochen sein kann,

5 n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,

Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff,  $-S(O)_p-$  oder  $-NR^9-$  steht,

10 p für 0, 1 oder 2 steht,

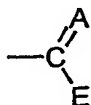
Z für  $-(CH_2)_r-$ ,  $-(CH_2)_t-(CHR^{10})-(CH_2)_w-$ ,  $-(CH_2)_r-C(O)-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-O-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-S(O)_p-(CH_2)_t-$ ,  $-(CH_2)_r-N(R^{11})-(CH_2)_t-$  oder  $-(CH_2)_t-C(R^{12})=C(R^{13})-(CH_2)_w-$  steht,

15

r für 1, 2, 3 oder 4 steht,

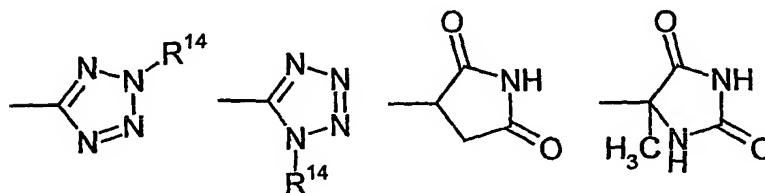
t und w unabhängig voneinander für 0, 1, 2, 3 oder 4 stehen,

20 R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe

25



steht,

- A für Sauerstoff oder Schwefel steht,
- E für -OR<sup>16</sup>, -SR<sup>16</sup>, -O-M, -S-M oder -NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup> steht,
- 5 M für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Phenyl, Benzyl oder Phenylethyl substituiertes Ammonium oder für ein Natriumkation (Na<sup>+</sup>) oder ein Kaliumkation (K<sup>+</sup>) steht,
- 10 M außerdem für ein Magnesiumkation (Mg<sup>2+</sup>) oder ein Calciumkation (Ca<sup>2+</sup>) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 15 R<sup>3</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welches 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,
- 20
- 25
- R<sup>4</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-carbonyl steht,
- 30
- R<sup>5</sup> für Wasserstoff, Amino, Formyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder

Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, Oxamoyl steht,

- 5            R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyliden; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Benzyliden steht,
- 10           R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen, gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der gegebenenfalls ein weiteres Stickstoff-, Sauerstoff- oder Schwefelatom enthalten kann und der gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein kann, steht,
- 15           R<sup>6</sup>        für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,
- 20           R<sup>7</sup>        für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl steht,
- 25           R<sup>8</sup>        für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- 30           R<sup>9</sup>        für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder

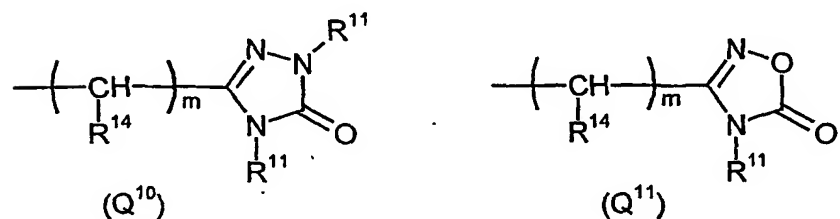
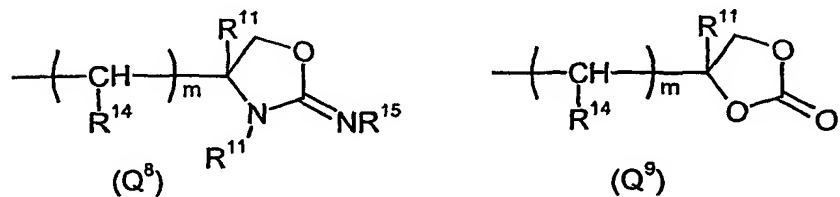
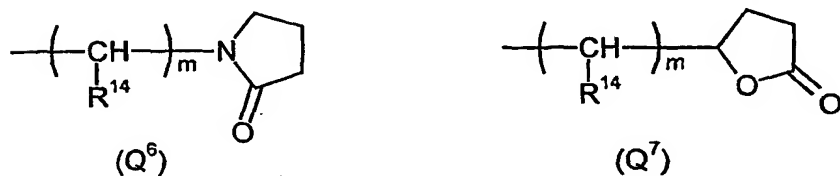
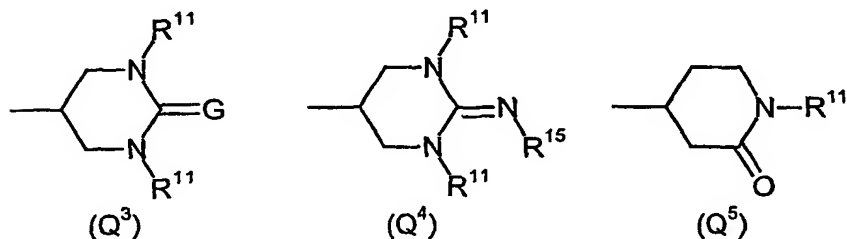
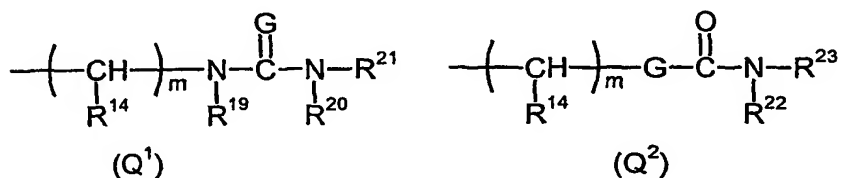
- 5                   Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 5- oder 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten, steht,
- 10                   R<sup>10</sup>   für Fluor, Chlor, Brom, Iod, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl; oder für Aryl oder Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl substituiert sein können, steht,
- 15                   R<sup>11</sup>   für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,
- R<sup>12</sup> und R<sup>13</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy stehen,
- 20                   R<sup>14</sup>   für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen steht,
- R<sup>15</sup>   für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, Cyano oder Di(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino steht,
- 25                   R<sup>16</sup>   für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>,
- 30

- 5                   -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, Decenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q steht,
- 10
- 15                   R<sup>16</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, Decenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl steht,
- 20
- 25                   R<sup>16</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,
- 30                   R<sup>17</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl steht,

- 5 R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylen)oxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche 10 jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht,
- 15 R<sup>18</sup> außerdem für jeweils einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxycarbonyl substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl; 20 oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl steht,
- 25 R<sup>18</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome 30 enthalten steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro und C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl ausgewählt werden können,

$R^{17}$  und  $R^{18}$  außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus, der 1 oder 2 weitere Heteroatome enthalten kann, welche 0 bis 2 Stickstoffatome, 0 oder 1 Sauerstoffatom und/oder 0 oder 1 Schwefelatom sein können, und der gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl substituiert sein kann, stehen,

Q für eine der folgenden Gruppierungen



steht, wobei die Reste  $R^{11}$  die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen steht,

5            m        für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit  $-(CHR^{14})-$  innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

10           G        für Sauerstoff oder Schwefel steht,

$R^{19}$  und  $R^{20}$  unabhängig voneinander für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder gemeinsam für  $C_2$ - $C_3$ -Alkylen stehen,

15            $R^{21}$         für Wasserstoff, für gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyloxy oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy substituiertes  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl; oder für gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Cyano,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Brom-  
20           atomen,  $C_1$ - $C_4$ -Alkylcarbonyl,  $C_1$ - $C_8$ -Alkoxycarbonyl,  $C_3$ - $C_5$ -Alkylen substituiertes Aryl steht,

$R^{22}$         für Wasserstoff,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl steht,

25            $R^{23}$         für Wasserstoff, Amino,  $C_1$ - $C_4$ -Alkyl oder  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy- $C_1$ - $C_4$ -alkyl steht.

6.        Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 5, in welcher

30            $R^{16}$         für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro,  $C_1$ - $C_4$ -Alkoxy,  $C_1$ - $C_4$ -Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor-



- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenylcarbonyloxy, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylen)oxy, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Aryloxy, Halogenaryloxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -C(R<sup>14</sup>)=N-OR<sup>14</sup> substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Decyl, Dodecyl, Tetradecyl, Hexadecyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, Decenyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkynyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy substituiertes Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, 4- bis 6-gliedriges, gesättigtes oder ungesättigtes, Heterocyclyl oder Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für einen der Reste Q steht,
- R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>-Alkenyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio mit 1 bis 9 Fluor-, Chlor- und/oder Bromatomen, Oxy(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylen)oxy substituiertes C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Aryl, Aryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Heteroaryl oder Heteroaryl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, welche jeweils 0 bis 3 Stickstoffatome, 0 bis 2 nicht benachbarte Sauerstoffatome und/oder 0 bis 2 nicht benachbarte Schwefelatome enthalten; oder für -S(O)<sub>p</sub>R<sup>3</sup>, -OR<sup>14</sup> oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht.

## 7. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 1, in welcher

5  $R^1$  und  $R^2$  unabhängig voneinander für Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl,  $-CF_3$ ,  $-CCl_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CClF_2$ ,  $-CHCl_2$ ,  $-CF_2CHFCl$ ,  $-CF_2CH_2F$ ,  $-CF_2CCl_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CF_2CHFCH_2F$ ,  $-CH_2CF_2H$ ,  $-CH_2CF_2CF_3$ ,  $-CF_2CF_2H$ ,  $-CF_2CHFCH_2F$ , Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy,  $-OCH_2CF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-SCHF_2$ ,  $-SO_2Me$ ,  $-SO_2CHF_2$ ,  $-SO_2CF_3$ ,  $-SOCHF_2$ ,  $-SOCH_2F$ ,  $-COMe$ ,  $-CO_2Me$ ,  $-CO_2Et$ , Amino, Cyclopentyl, Cyclohexyl; jeweils gegebenenfalls durch Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethyl, Trifluormethoxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Pyridinyl, Furyl, Furfuryl stehen,

15  $R^1$  und  $R^2$  außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen,  $-(CH_2)_2-O-CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-NH-CH_2-$ ,  $-CH=CH-N=CH-$ ,  $-CH=CCl-CH=CH-$  stehen,

20 X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl,  $-CF_3$ ,  $-CCl_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CClF_2$ ,  $-CHCl_2$ ,  $-CF_2CHFCl$ ,  $-CF_2CH_2F$ ,  $-CF_2CCl_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CF_2CHFCH_2F$ ,  $-CH_2CF_2H$ ,  $-CH_2CF_2CF_3$ ,  $-CF_2CF_2H$ ,  $-CF_2CHFCH_2F$ , Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy,  $-OCH_2CF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-SCHF_2$ ,  $-SO_2Me$ ,  $-SO_2CHF_2$ ,  $-SO_2CF_3$ ,  $-SOCHF_2$ ,  $-SOCH_2F$ ,  $-CH=CH_2$ ,  $-C\equiv CH$ , Amino,  $-NHMe$ ,  $-NMe_2$ ,  $-CHO$ ,  $-COMe$ ,  $-CO_2Me$ ,  $-CO_2Et$ ,  $-NHCOMe$ , Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazolyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl; oder wenn n für 2 steht,

25 stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylen oder Butadienylen,  $-(CH_2)_2-O-CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-NH-CH_2-$ ,  $-CH=CH-N=CH-$  steht,

30

- 214 -

- X außerdem für Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, i-Propylthio steht,
- n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,

5

- Y für eine direkte Bindung, Sauerstoff,  $-S(O)_p-$  oder  $-NR^9-$  steht,

- p für 0, 1 oder 2 steht,

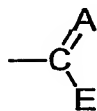
10

- Z für  $-CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_3-$ ,  $-(CH_2)_4-$ ,  $-(CHR^{10})-$ ,  $-CH_2-C(O)-CH_2-$ ,  $-CH_2-NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-CH_2-CH=CH-$ ,  $-CH=C(OH)-$ ,  $-CH=C(OMe)-$ ,  $-CH_2-C(OMe)=CH-$  steht,

- Z außerdem für  $-CH_2-C(OEt)=CH-$  steht,

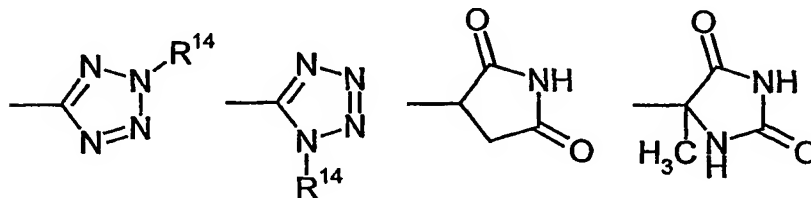
15

- R für die Gruppierung



oder für ein Carbonsäurebioisoster (Säuremimic), insbesondere aus der Gruppe

20



steht,

25

- A für Sauerstoff oder Schwefel steht,

- E für  $-OR^{16}$ ,  $-SR^{16}$ ,  $-O-M$  oder  $-NR^{17}R^{18}$  steht,

- M für Tetrabutylammonium, Trimethylbenzylammonium oder für ein Natriumkation ( $\text{Na}^+$ ) oder ein Kaliumkation ( $\text{K}^+$ ) steht,
- 5 M außerdem für ein Magnesiumkation ( $\text{Mg}^{2+}$ ) oder ein Calciumkation ( $\text{Ca}^{2+}$ ) steht, wobei jeweils zwei Moleküle einer Verbindung ein Salz mit einem solchen Ion bilden,
- 10 R<sup>4</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe steht,
- R<sup>5</sup> für Wasserstoff, Amino, Formyl, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Propargyl, Methoxy, Methoxymethyl, -COMe, -COEt, t-Butoxycarbonyl, Oxamoyl steht,
- 15 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam für Ethyliden, i-Propyliden, s-Butyliden, Nitrobenzyliden stehen,
- 20 R<sup>4</sup> und R<sup>5</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten oder ungesättigten Heterocyclus aus der Reihe Morpholin, Piperidin, Thiomorpholin, Pyrrolidin, Tetrahydropyridin, der gegebenenfalls einfach oder zweifach durch Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl substituiert sein kann, stehen,
- 25 R<sup>8</sup> für Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CHCl<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H oder für -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> steht,
- 30 R<sup>9</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Cyclopropyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl steht,

- 5 R<sup>10</sup> für Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -COMe, -COEt, -CO<sub>2</sub>Me, -CO<sub>2</sub>Et, Cyclohexyl; Phenyl oder Benzyl, welche ihrerseits im Arylteil einfach bis vierfach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom oder Methyl substituiert sein können steht,
- 10 R<sup>11</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl steht,
- R<sup>14</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl oder t-Butyl steht,
- 15 R<sup>15</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl oder Cyano steht,
- 20 R<sup>16</sup> für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl, Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy, -O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-O-, Oxetanyl, Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorphenoxy, -CONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -ONR<sup>4</sup>R<sup>5</sup>, -CH=N-OCH<sub>3</sub> substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, -CF<sub>3</sub>, -CCl<sub>3</sub>, -CHF<sub>2</sub>, -CClF<sub>2</sub>, -CHCl<sub>2</sub>, -CF<sub>2</sub>CHFCl, -CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>F, -CF<sub>2</sub>CCl<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>H, -CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-
- 25
- 30

- methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -CO<sub>2</sub>Me, -CO<sub>2</sub>Et, Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazolylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazolylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxidethyl; oder für einen der Reste Q steht,
- R<sup>16</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl, Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl, Ethinyl, Propinyl, Butinyl steht,
- R<sup>16</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis vierfach, gleich oder verschieden substituiertes Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl, Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl,

5 Cyclobutylethyl, Cyclopentylethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazyl, Triazinyl, Triazolyl, Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietan-  
 10 dioxid, Oxetanylmethyl, Oxazolanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl, Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl, Pyrimidinylmethyl, Pyridazylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolylmethyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietan-  
 15 ylmethyl, Thietandioxidmethyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanylethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl, Isoxazolethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl, Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxidethyl steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Hydroxy und Nitro ausgewählt werden können,

R<sup>17</sup> für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht,

20 R<sup>18</sup> für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH<sub>2</sub>-O-substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für -SO<sub>2</sub>Me, -SO<sub>2</sub>Et oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht,

30 R<sup>18</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano, Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy, -OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>,

5

Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils gegebenenfalls bis zur maximal möglichen Zahl, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor und/oder Brom substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl steht,

10

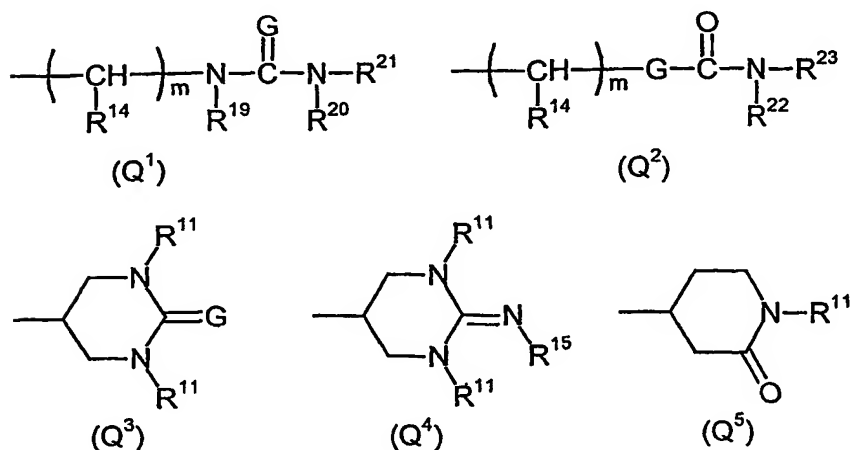
R<sup>18</sup> außerdem für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl steht, wobei die Substituenten zusätzlich zu den oben genannten aus Nitro, Methoxycarbonyl und Ethoxycarbonyl ausgewählt werden können,

15

R<sup>17</sup> und R<sup>18</sup> außerdem gemeinsam mit dem Stickstoffatom, an das sie gebunden sind, für einen 5- oder 6-gliedrigen gesättigten Heterocyclus aus der Reihe Piperazin, Morpholin, Piperidin, Pyrrolidin, welcher gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Methyl, Ethyl, n-Propyl oder i-Propyl substituiert sein kann, steht,

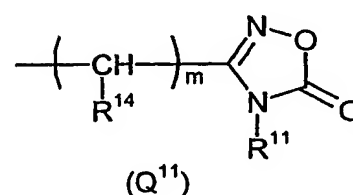
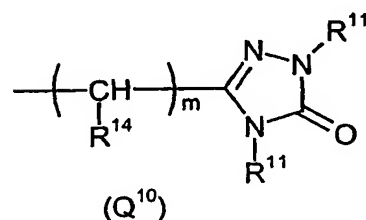
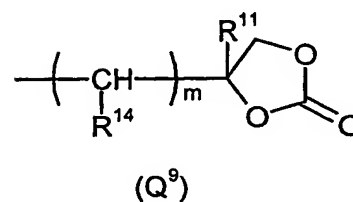
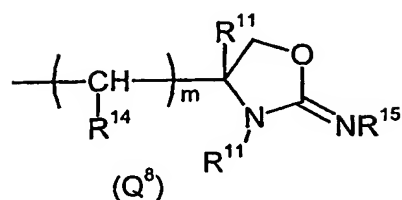
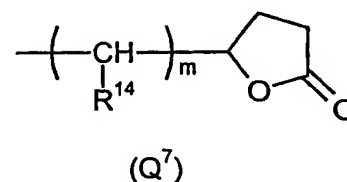
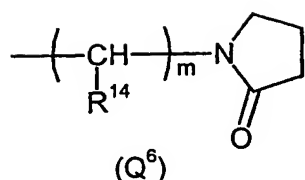
20

Q für eine der folgenden Gruppierungen



25





5 steht, wobei die Reste R<sup>11</sup> die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben können, wenn sie mehrfach in derselben heterocyclischen Gruppierung vorkommen steht,

10 m für 0, 1, 2 oder 3 steht, wobei die Wiederholungseinheit -(CHR<sup>14</sup>)- innerhalb der Seitenkette einer heterocyclischen Gruppierung die gleiche oder verschiedene Bedeutungen haben kann, wenn m für 2 oder 3 steht,

15 G für Sauerstoff oder Schwefel steht,

R<sup>19</sup> und R<sup>20</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, oder gemeinsam für -(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>- oder -(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>- steht,

20 R<sup>21</sup> für Wasserstoff, für jeweils gegebenenfalls einfach durch t-Butyl-carbonyloxy oder Methoxy substituiertes Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach oder zweifach, gleich oder verschieden durch Chlor,

Cyano, Methyl, Ethyl, t-Butyl, Trifluormethyl, s-Butyloxycarbonyl, t-Butyloxycarbonyl, n-Octyloxycarbonyl,  $-(CH_2)_4$ - substituiertes Phenyl steht,

5 R<sup>22</sup> für Wasserstoff, Methyl, Ethyl oder Methoxymethyl steht,

R<sup>23</sup> für Wasserstoff, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl oder Methoxymethyl steht.

10 8. Pyridylpyrimidine der Formel (I) gemäß Anspruch 7, in welcher

X für Fluor, Chlor, Brom, Nitro, Cyano, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl,  $-CF_3$ ,  $-CCl_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CClF_2$ ,  $-CHCl_2$ ,  $-CF_2CHFCl$ ,  $-CF_2CH_2F$ ,  $-CF_2CCl_3$ ,  $-CH_2CF_3$ ,  $-CF_2CHFCF_3$ ,  $-CH_2CF_2H$ ,  $-CH_2CF_2CF_3$ ,  $-CF_2CF_2H$ ,  $-CF_2CHFCF_3$ , Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, Trifluormethoxy, Trichlormethoxy,  $-OCH_2CF_3$ ,  $-SCF_3$ ,  $-SCHF_2$ ,  $-SO_2Me$ ,  $-SO_2CHF_2$ ,  $-SO_2CF_3$ ,  $-SOCHF_2$ ,  $-SOCF_3$ ,  $-CH=CH_2$ ,  $-C\equiv CH$ , Amino,  $-NHMe$ ,  $-NMe_2$ ,  $-CHO$ ,  $-COMe$ ,  $-CO_2Me$ ,  $-CO_2Et$ ,  $-NHCOMe$ , Cyclopentyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl, Thiazolyl, Pyridyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl; oder wenn n für 2 steht, stehen zwei benachbarte Reste X außerdem gemeinsam für Propylen, Butylen, Propenylene oder Butadienylene,  $-(CH_2)_2-O-CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-NH-CH_2-$ ,  $-CH=CH-N=CH-$  steht,

15

20

25

Z für  $-CH_2-$ ,  $-(CH_2)_2-$ ,  $-(CH_2)_3-$ ,  $-(CH_2)_4-$ ,  $-(CHR^{10})-$ ,  $-CH_2-C(O)-CH_2-$ ,  $-CH_2-NH-$ ,  $-CH=CH-$ ,  $-CH_2-CH=CH-$ ,  $-CH=C(OH)-$ ,  $-CH=C(OMe)-$ ,  $-CH_2-C(OMe)=CH-$  steht,

30

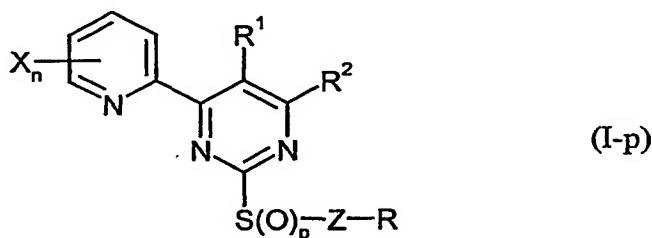
R<sup>16</sup> für Wasserstoff; für jeweils gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Amino, Hydroxy, Cyano,

Nitro, Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy, Trifluormethoxy,  $-OCH_2CF_3$ ,  
 Trichlormethoxy, Difluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio,  
 Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, i-Propoxycarbonyl, t-Butoxycarbonyl,  
 Methylcarbonyloxy, Vinylcarbonyloxy,  $-O-(CH_2)_2-O-$ , Oxetanyl,  
 5 Dioxanyl, Oxazolidinyl, Dioxolanyl, Phenoxy, Fluorophenoxy,  
 $-CONR^4R^5$ ,  $-NR^4R^5$ ,  $-ONR^4R^5$ ,  $-CH=N-OCH_3$  substituiertes Methyl,  
 Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, n-Pentyl,  
 Isopentyl, Siamyl, Hexyl, n-Decyl, n-Dodecyl, n-Tetradecyl, n-  
 Hexadecyl, Vinyl, Allyl, Butenyl, 2-Isopentenyl, Hexenyl, n-Decenyl,  
 10 Ethinyl, Propinyl, Butinyl; oder für jeweils gegebenenfalls einfach bis  
 dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Brom, Methyl,  
 Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl,  $-CF_3$ ,  
 $-CCl_3$ ,  $-CHF_2$ ,  $-CClF_2$ ,  $-CHCl_2$ ,  $-CF_2CHFCF_3$ ,  $-CF_2CH_2F$ ,  $-CF_2CCl_3$ ,  
 $-CH_2CF_3$ ,  $-CF_2CHFCF_3$ ,  $-CH_2CF_2H$ ,  $-CH_2CF_2CF_3$ ,  $-CF_2CF_2H$ ,  
 15  $-CF_2CHFCF_3$ , Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, n-Butoxy, Trifluor-  
 methoxy, Trichlormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio,  $-CO_2Me$ ,  
 $-CO_2Et$ , Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy substituiertes Phenyl,  
 Benzyl, Phenylethyl, Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclo-  
 hexyl, Cyclopropylmethyl, Cyclobutylmethyl, Cyclopentylmethyl,  
 20 Cyclohexylmethyl, Cyclopropylethyl, Cyclobutylethyl, Cyclopentyl-  
 ethyl, Cyclohexylethyl, Oxetanyl, Oxazolanyl, Dioxanyl, Dioxolanyl,  
 Furyl, Thienyl, Pyrrolyl, Oxazolyl, Isoxazolyl, Imidazolyl, Pyrazyl,  
 Thiazolyl, Pyridinyl, Pyrimidinyl, Pyridazolyl, Triazinyl, Triazolyl,  
 Tetrahydropyranyl, Thietanyl, Thietandioxid, Oxetanylmethyl, Oxazo-  
 25 lanylmethyl, Dioxanylmethyl, Dioxolanylmethyl, Furylmethyl,  
 Thienylmethyl, Pyrrolylmethyl, Oxazolylmethyl, Isoxazolylmethyl,  
 Imidazolylmethyl, Pyrazylmethyl, Thiazolylmethyl, Pyridinylmethyl,  
 Pyrimidinylmethyl, Pyridazolylmethyl, Triazinylmethyl, Triazolyl-  
 methyl, Tetrahydropyranylmethyl, Thietanylmethyl, Thietandioxid-  
 30 methyl, Oxetanylethyl, Oxazolanylethyl, Dioxanylethyl, Dioxolanyl-  
 ethyl, Furylethyl, Thienylethyl, Pyrrolylethyl, Oxazolylethyl,  
 Isoxazolylethyl, Imidazolylethyl, Pyrazylethyl, Thiazolylethyl,

Pyridinylethyl, Pyrimidinylethyl, Pyridazylethyl, Triazinylethyl, Triazolylethyl, Tetrahydropyranylethyl, Thietanylethyl, Thietandioxid-ethyl; oder für einen der Reste Q steht,

- 5  $R^{18}$  für Wasserstoff, Hydroxy, Amino, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Vinyl, Allyl; oder für jeweils  
 10 gegebenenfalls einfach bis dreifach, gleich oder verschieden durch Fluor, Chlor, Hydroxy, Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, s-Butyl, i-Butyl, t-Butyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Methoxy, Ethoxy, Trifluormethoxy, Methylthio, Trifluormethylthio, -O-CH<sub>2</sub>-O-substituiertes Cyclopropyl, Cyclopropylmethyl, Cyclohexyl, Phenyl, Benzyl, Phenylethyl, Pyridinyl, Pyridinylmethyl, Pyridinylethyl, Furyl, Furfuryl; oder für -SO<sub>2</sub>Me, -SO<sub>2</sub>Et oder -NR<sup>4</sup>R<sup>5</sup> steht.

- 15 9. Pyridylpyrimidine der Formel (I-p)

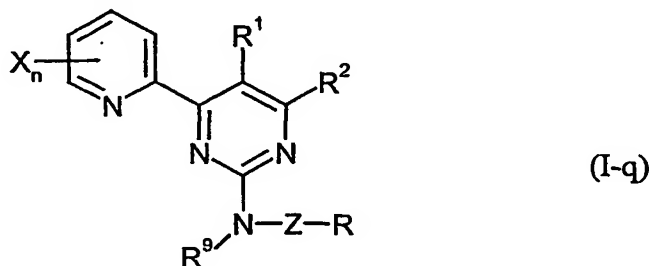


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X, n, p, Z und R die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

20

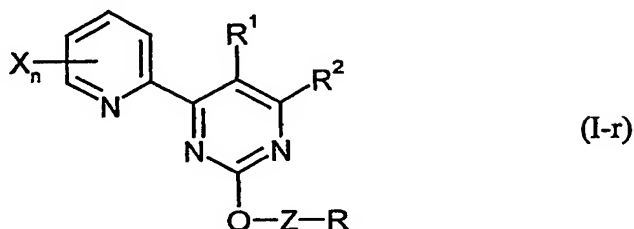
10. Pyridylpyrimidine der Formel (I-q)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$ ,  $R$  und  $R^9$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

11. Pyridylpyrimidine der Formel (I-r)

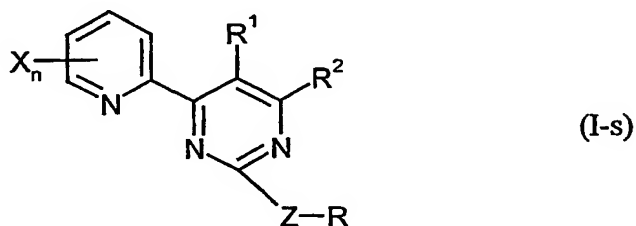


5

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

10 12. Pyridylpyrimidine der Formel (I-s)

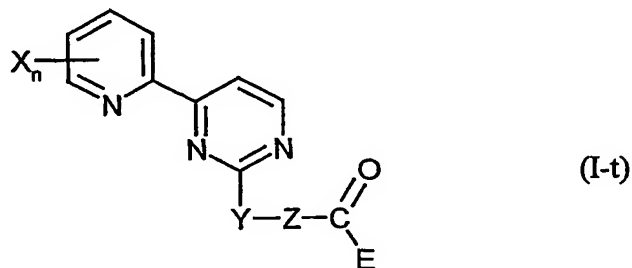


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

15

13. Pyridylpyrimidine der Formel (I-t)



in welcher

X für Methyl, Ethyl, Chlor, Brom,  $-CF_3$ , Methoxy oder Trifluormethoxy steht,

n für 0, 1 oder 2 steht, wobei X für gleiche oder verschiedene Reste steht, wenn n für 2 steht,

Y für  $-S-$  oder  $-NR^9-$  steht,

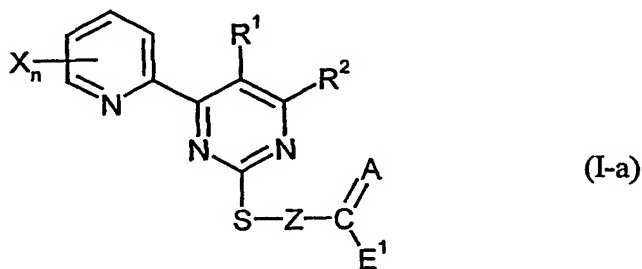
Z für  $-CH_2-$  oder  $-(CH_2)_2-$  steht,

E für Hydroxy, Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, i-Propoxy, n-Butoxy, i-Butoxy, s-Butoxy, t-Butoxy,  $-NH-SO_2Me$  oder  $-NH-SO_2Et$  steht,

$R^9$  für Wasserstoff, Methyl oder Ethyl steht.

14. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet,

dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-a)



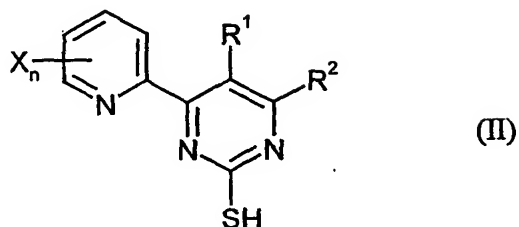
in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

$E^1$  für  $-OR^{16}$ ,  $-SR^{16}$  oder  $-NR^{17}R^{18}$  steht,

erhält, indem man

A) Thiole der Formel (II)



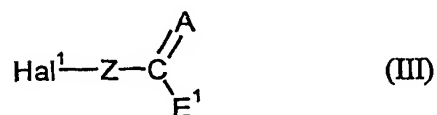
5

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

10

mit Halogen-Verbindungen der Formel (III)



in welcher

15

Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

$E^1$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

$Hal^1$  für Halogen steht,

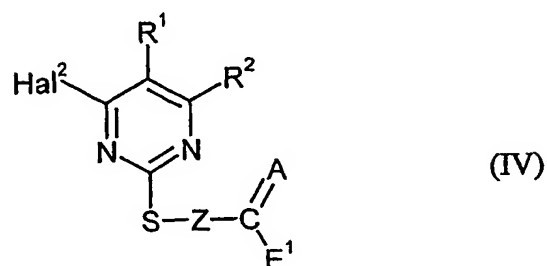
20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels umgesetzt,

oder

25

B) Halogenpyrimidine der Formel (IV)



in welcher

5

$R^1$ ,  $R^2$ , Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

$E^1$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

10

$Hal^2$  für Halogen steht,

mit Pyridin-Verbindungen der Formel (V)



15

in welcher

X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

L für  $Sn(Alkyl)_3$ ,  $Sn(Aryl)_3$ , ZnBr oder ZnCl steht,

20

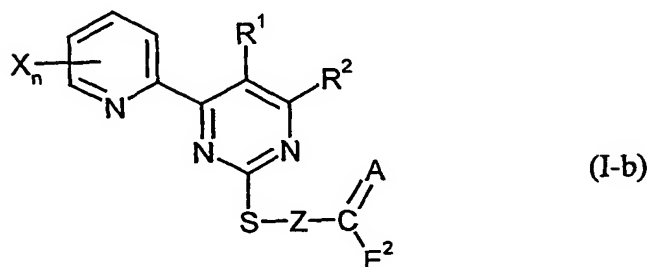
gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators umgesetzt,

oder

25



C) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-b)



in welcher

5

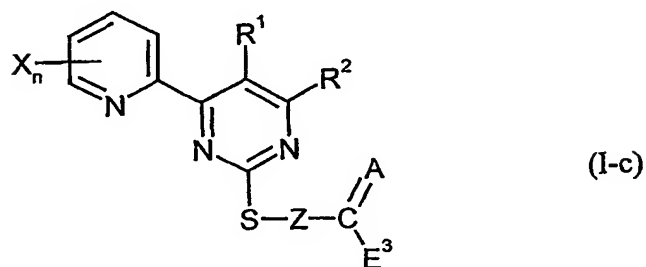
$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $A$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

$E^2$  für  $-NR^{17}R^{18}$  steht,

10

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-c)



15

in welcher

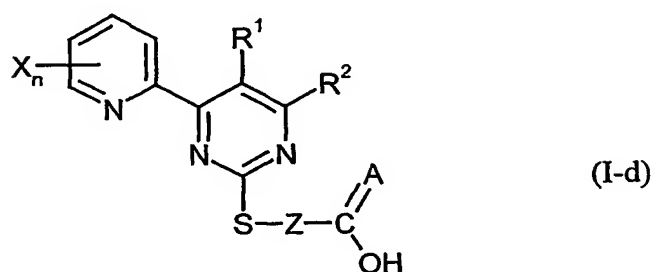
$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $A$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

20

$E^3$  für  $-OR^{16}$  steht, wobei  $R^{16}$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

in einer ersten Stufe gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels mit einer Base behandelt und die entstandene Verbindung der Formel (I-d)

5

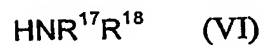


in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $A$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

10

in einer zweiten Stufe mit Aminen der Formel (VI)



15

in welcher

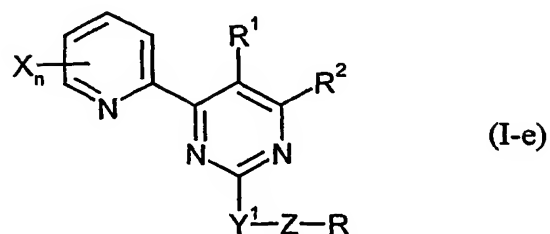
$R^{17}$  und  $R^{18}$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

20

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines wasserabsorbierenden Reagenzes umgesetzt,

oder

D) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-e)



in welcher

5

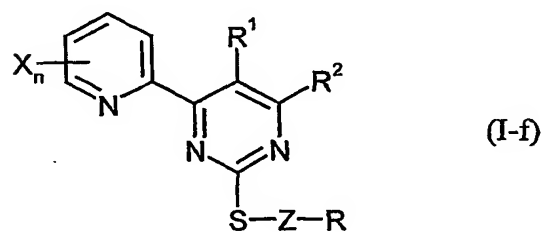
$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

$Y^1$  für -SO- oder -SO<sub>2</sub>- steht,

10

erhält, indem man

Pyridylpyrimidine der Formel (I-f)



15

in welcher

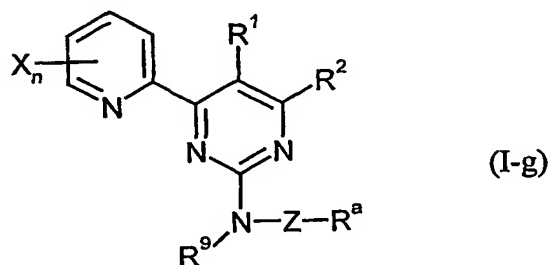
$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

20.

mit einem Oxidationsmittel gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels, gegebenenfalls in Gegenwart eines Säurebindemittels und gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators oxidiert,

oder

E) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-g)



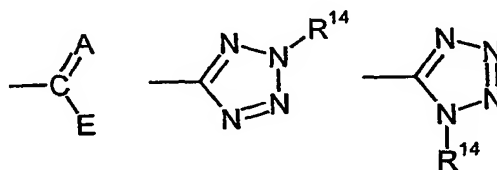
5

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R^9$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

10

$R^a$  für eine der folgenden Gruppierungen steht



in welcher

15

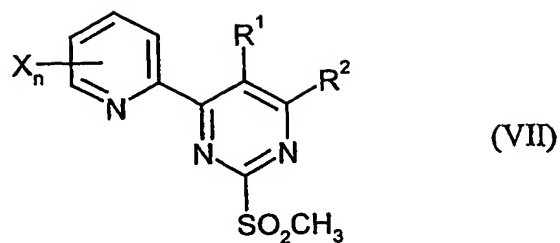
$R^{14}$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

20

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

- 232 -



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Aminen der Formel (VIII)



in welcher

10

Z und  $R^9$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

$R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

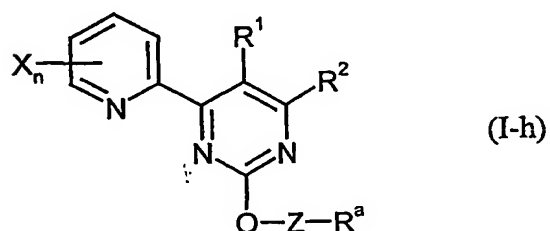
15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

oder

20

F) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-h)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$  und  $Z$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

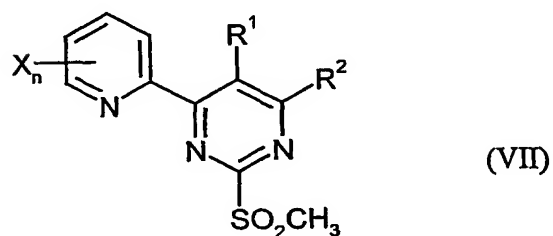
5

$R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

10

Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)



in welcher

15

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$  und  $n$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

mit Hydroxy-Verbindungen der Formel (IX)



20

in welcher

$Z$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

$R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

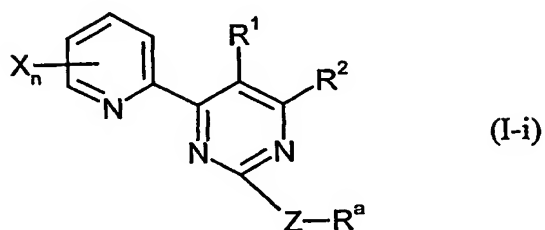
25

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

oder

G) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-i)

5



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$  und  $Z$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

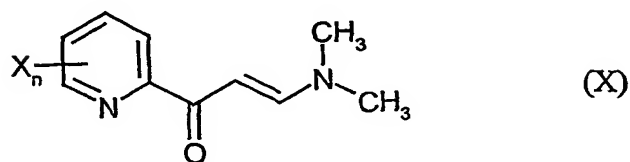
10

$R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

15

Pyridin-Derivate der Formel (X)



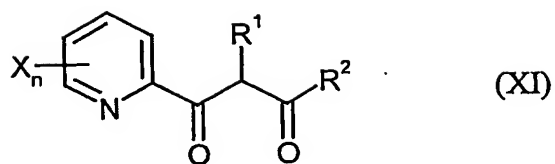
in welcher

20

$X$  und  $n$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

oder Pyridin-Derivate der Formel (XI)

- 235 -



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

5

mit Amidinen der Formel (XII)



in welcher

10

Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

$R^a$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

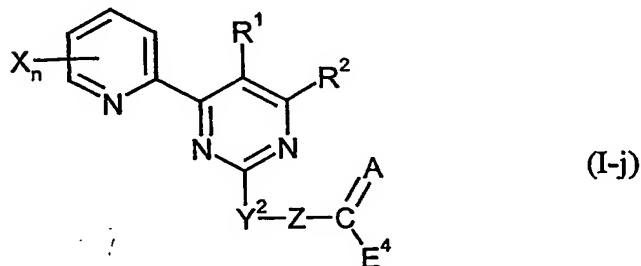
15

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und gegebenenfalls in Gegenwart einer Base umgesetzt,

oder

20

H) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-j)



in welcher



- 236 -

Y<sup>2</sup> für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR<sup>9</sup>- steht,

E<sup>4</sup> für -O-M oder -S-M steht und

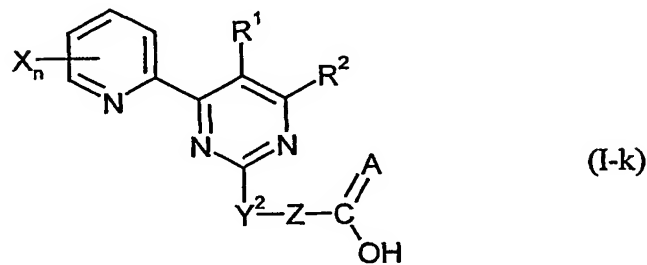
5

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n, Z, A und M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

erhält, indem man

10

Pyridylpyrimidine der Formel (I-k)



in welcher

15

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n, Z und A die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen hat,

20

mit Hydroxiden der Formel (XIII)



in welcher

25

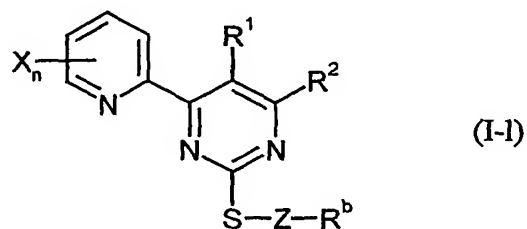
M die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

- 237 -

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt,

oder

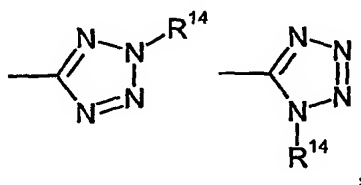
5 J) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-I)



in welcher

10  $R^1$ ,  $R^2$ , X, n, Y und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben und

$R^b$  für eine der folgenden Gruppierungen steht



15

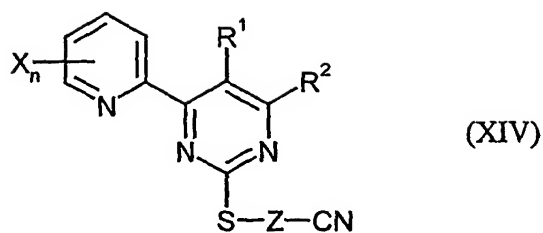
worin  $R^{14}$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

20

Nitrile der Formel (XIV)

- 238 -



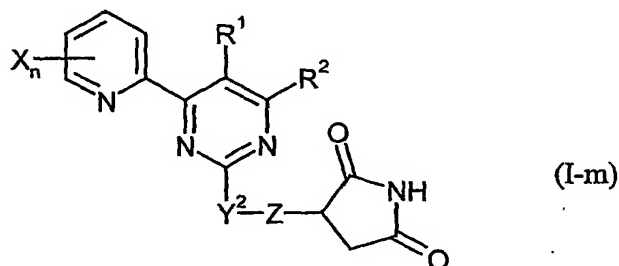
in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen  
haben

mit Trialkylzinnaziden gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdün-  
nungsmittels umgesetzt,

10 oder

K) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-m)



15 in welcher

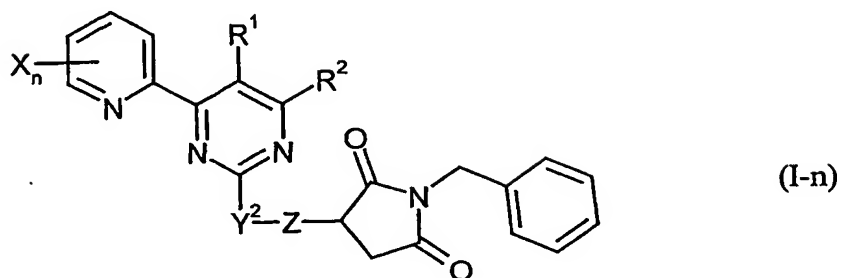
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen  
haben,

20 Y<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen hat,

erhält, indem man

- 239 -

Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)



in welcher

5

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$  und  $Z$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

$Y^2$  die oben angegebenen Bedeutungen hat,

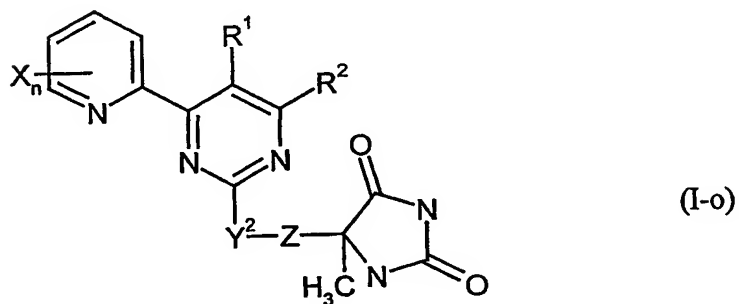
10

gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels und in Gegenwart eines Katalysators hydriert,

oder

15

L) dass man Pyridylpyrimidine der Formel (I-o)



in welcher

20

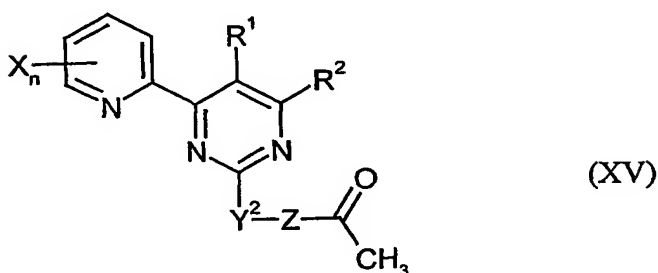
R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

Y<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen hat,

5

erhält, indem man

Keto-Verbindungen der Formel (XV)



10

in welcher

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben,

15

Y<sup>2</sup> die oben angegebenen Bedeutungen hat,

mit Ammoniumcarbonat und Kaliumcyanid gegebenenfalls in Gegenwart eines Verdünnungsmittels umgesetzt.

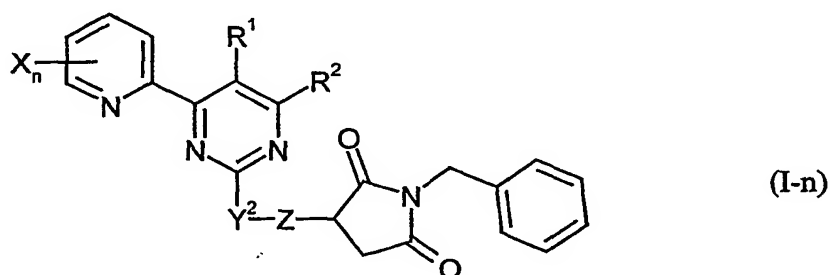
20

15. Schädlingsbekämpfungsmittel, gekennzeichnet durch einen Gehalt an mindestens einer Verbindung der Formel (I) gemäß Anspruch 1 neben Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen.

25

16. Verwendung von Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.

17. Verfahren zur Bekämpfung von Schädlingen, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 auf Schädlinge und/oder ihren Lebensraum einwirken lässt.
- 5 18. Verfahren zur Herstellung von Schädlingsbekämpfungsmitteln, dadurch gekennzeichnet, dass man Verbindungen der Formel (I) gemäß Anspruch 1 mit Streckmitteln und/oder oberflächenaktiven Stoffen vermischt.
- 10 19. Pyridylpyrimidine der Formel (I-n)

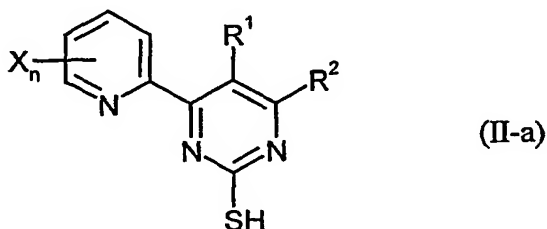


in welcher

Y<sup>2</sup> für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder -NR<sup>9</sup>- steht,

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X, n, Z und R<sup>9</sup> die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

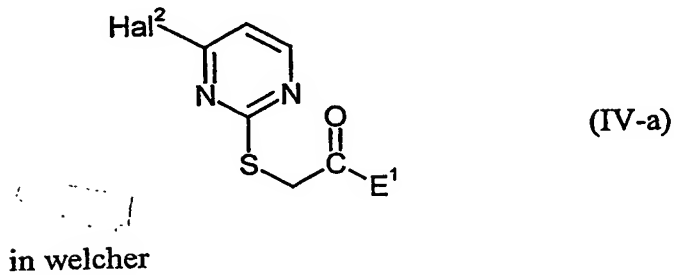
20. Thiole der Formel (II-a)



in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben, mit der Maßgabe, dass wenigstens einer der Reste  $R^1$ ,  $R^2$  oder X nicht für Wasserstoff steht.

5      21. Halogenpyrimidine der Formel (IV-a)

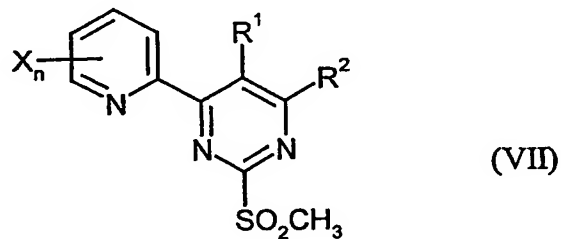


- 10      a)     $E^1$     für Methoxy oder Ethoxy steht und  
           $Hal^2$     für Brom steht,

oder

- 15      b)     $E^1$     für Methoxy steht und  
           $Hal^2$     für Chlor steht.

22. Methylsulfonylpyrimidine der Formel (VII)

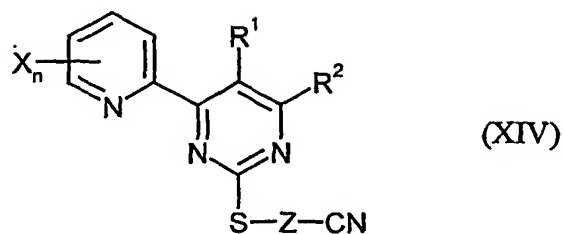


20

in welcher

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

## 23. Nitrile der Formel (XIV)

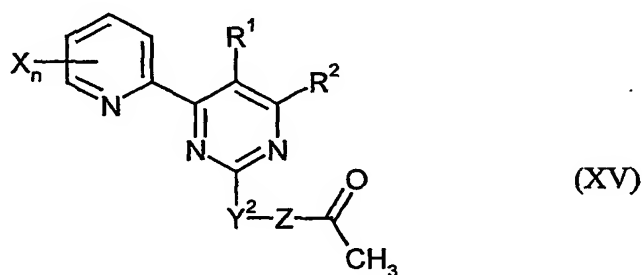


in welcher

5

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$  und  $Z$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

## 24. Keto-Verbindungen der Formel (XV)



10

in welcher

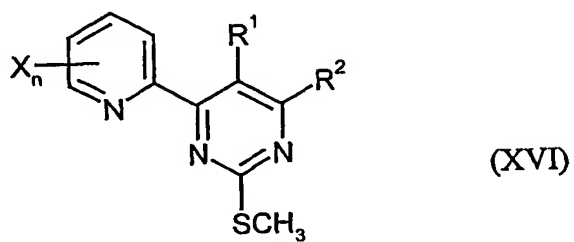
$Y^2$  für eine direkte Bindung, Sauerstoff, Schwefel oder  $-NR^9-$  steht,

15

$R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$ ,  $n$ ,  $Z$  und  $R^9$  die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.



## 25. Methylthio-Derivate der Formel (XVI)



in welcher

5

$R^1$ ,  $R^2$ , X und n die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

IPC 7 A01N43/54 A01N43/647 A01N43/653 A01N43/707 A01N43/74  
 A01N43/76 A01N43/78 A01N43/80 C07D401/04 C07D401/14  
 C07D405/14 C07D409/14 C07D417/14 C07D413/14

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages   | Relevant to claim No. |
|------------|--|-----------------------|
| X          | PATENT ABSTRACTS OF JAPAN<br>vol. 017, no. 532 (P-1619),<br>24 September 1993 (1993-09-24)<br>& JP 05 143796 A (IKUO NAGATA),<br>11 June 1993 (1993-06-11)<br>Zweite Verbindung in der linken Spalte<br>page 877 | 1-8, 12,<br>13        |
| X          | WO 00 61586 A (AKZO NOBEL NV ; ADANG ANTON<br>EGBERT PETER (NL); GERRITSMa GERRILDINA)<br>19 October 2000 (2000-10-19)<br>example 16<br>---<br>-/--  | 1-8, 12,<br>13        |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents:

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*G\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

2 May 2002

Date of mailing of the international search report

08/05/2002

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Fritz, M

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages  | Relevant to claim No. |
|------------|---|-----------------------|
| X          | SAR ET AL.: "Synthesis, Oxidation and Claisen Rearrangement of 4-(Allyloxy)phenyl-1,4-dihydropyridines and -pyrimidines"<br>ACH MODELS CHEM.,<br>vol. 131, no. 3-4, 1994, pages 363-376,<br>XP001070105<br>Verbindung 11h<br>page 366<br>---  | 25                    |
| X          | CORONA DEL L ET AL: "SYNTHESIS AND IN VITRO STUDY OF PLATELET ANTIAGGREGANT ACTIVITY OF 2(4)-IMIDAZOL-1-YL-4(2)-CYCLOALKYLAMINO PYRIMIDINES"<br>EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY,<br>EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR,<br>vol. 26, 1991, pages 729-733, XP002064599<br>ISSN: 0223-5234<br>Erste Verbindung in Scheme 2<br>page 730<br>--- | 21                    |
| A          | DE 40 31 798 A (HOECHST AG)<br>9 April 1992 (1992-04-09)<br>the whole document<br>---   | 1-25                  |
| P,X        | WO 01 87849 A (KANE JOHN L ;QIAO SHUANG (US); VINICK FRED (US); GENZYME CORP (US))<br>22 November 2001 (2001-11-22)<br>page 39, line 6 - line 22<br>-----   | 25                    |

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s)  | Publication<br>date  |
|---|---|---------------------|---|--|
| JP 05143796                               | A | 11-06-1993          | NONE  |  |
| WO 0061586                                | A | 19-10-2000          | AU 3816600 A<br>BR 0009558 A<br>CZ 20013605 A3<br>WO 0061586 A1<br>EP 1171443 A1<br>NO 20014824 A | 14-11-2000<br>19-02-2002<br>13-03-2002<br>19-10-2000<br>16-01-2002<br>04-10-2001 |
| DE 4031798                                | A | 09-04-1992          | DE 4031798 A1   | 09-04-1992   |
| WO 0187849                                | A | 22-11-2001          | AU 5969101 A<br>WO 0187849 A2   | 26-11-2001<br>22-11-2001   |

## Continuation of box I.2

The search yielded already in the initial phase a very large number of novelty-destroying documents for claim 1. These documents are so numerous that it is impossible to establish for what subject matter protection could be justifiably sought for the totality of the claims. (Art. 6 PCT). For this reason a meaningful search covering the entire scope of protection sought is impossible. The search was therefore restricted to:

The compounds (I) as defined in claim 1, wherein the term "bioisoster" (used in the definition of R) represents the groups (i.e.  $-C(=A)-E$  and the structural formulae on page 188) actually indicated in said claim.

The applicant's attention is drawn to the fact that claims, or parts of claims relating to inventions in respect of which no international search report has been established need not be the subject of an international preliminary examination (Rule 66.1(e) PCT). EPO policy, when acting as an International Preliminary Examining Authority, is normally not to carry out a preliminary examination on matter which has not been searched. This is the case, irrespective of whether or not the claims are amended following receipt of the search report (Article 19 PCT) or during any Chapter II procedure whereby the applicant provides new claims.

## A. KLASSIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES

IPK 7 A01N43/54 A01N43/647 A01N43/653 A01N43/707 A01N43/74  
 A01N43/76 A01N43/78 A01N43/80 C07D401/04 C07D401/14  
 C07D405/14 C07D409/14 C07D417/14 C07D413/14

Nach der internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierter Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 7 A01N C07D

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal, WPI Data, PAJ, CHEM ABS Data

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile  | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|---|--------------------|
| X          | PATENT ABSTRACTS OF JAPAN<br>vol. 017, no. 532 (P-1619),<br>24. September 1993 (1993-09-24)<br>& JP 05 143796 A (IKUO NAGATA),<br>11. Juni 1993 (1993-06-11)<br>Zweite Verbindung in der linken Spalte<br>Seite 877 | 1-8, 12,<br>13     |
| X          | WO 00 61586 A (AKZO NOBEL NV ; ADANG ANTON<br>EGBERT PETER (NL); GERRITSMAN GERRILDINA)<br>19. Oktober 2000 (2000-10-19)<br>Beispiel 16   | 1-8, 12,<br>13     |

-/-

☒ Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

☒ Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

\*A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

\*E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

\*L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

\*O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

\*P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

\*T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

\*X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

\*Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

\*Z\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

2. Mai 2002

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

08/05/2002

Name und Postanschrift der internationalen Recherchenbehörde

Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentlaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Fritz, M

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

| Kategorie* | Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile   | Betr. Anspruch Nr. |
|------------|--|--------------------|
| X          | SAR ET AL.: "Synthesis, Oxidation and Claisen Rearrangement of 4-(Allyloxy)phenyl-1,4-dihydropyridines and -pyrimidines"<br>ACH MODELS CHEM.,<br>Bd. 131, Nr. 3-4, 1994, Seiten 363-376,<br>XP001070105<br>Verbindung 11h<br>Seite 366   | 25                 |
| X          | ---<br>CORONA DEL L ET AL: "SYNTHESIS AND IN VITRO STUDY OF PLATELET ANTIAGGREGANT ACTIVITY OF 2(4)-IMIDAZOL-1-YL-4(2)-CYCLOALKYLAMINO PYRIMIDINES"<br>EUROPEAN JOURNAL OF MEDICINAL CHEMISTRY, EDITIONS SCIENTIFIQUE ELSEVIER, PARIS, FR, Bd. 26, 1991, Seiten 729-733, XP002064599<br>ISSN: 0223-5234<br>Erste Verbindung in Scheme 2<br>Seite 730 | 21                 |
| A          | ---<br>DE 40 31 798 A (HOECHST AG)<br>9. April 1992 (1992-04-09)<br>das ganze Dokument   | 1-25               |
| P,X        | ---<br>WO 01 87849 A (KANE JOHN L ;QIAO SHUANG (US); VINICK FRED (US); GENZYME CORP (US))<br>22. November 2001 (2001-11-22)<br>Seite 39, Zeile 6 - Zeile 22<br>-----   | 25                 |

| Im Recherchenbericht<br>angeführtes Patentdokument |   | Datum der<br>Veröffentlichung | Mitglied(er) der<br>Patentfamilie |             | Datum der<br>Veröffentlichung |
|--|---|-------------------------------|-----------------------------------|-------------|-------------------------------|
| JP 05143796  | A | 11-06-1993                    | KEINE                             |             |                               |
| WO 0061586   | A | 19-10-2000                    | AU                                | 3816600 A   | 14-11-2000                    |
|  |   |                               | BR                                | 0009558 A   | 19-02-2002                    |
|  |   |                               | CZ                                | 20013605 A3 | 13-03-2002                    |
|  |   |                               | WO                                | 0061586 A1  | 19-10-2000                    |
|  |   |                               | EP                                | 1171443 A1  | 16-01-2002                    |
|  |   |                               | NO                                | 20014824 A  | 04-10-2001                    |
| DE 4031798   | A | 09-04-1992                    | DE                                | 4031798 A1  | 09-04-1992                    |
| WO 0187849   | A | 22-11-2001                    | AU                                | 5969101 A   | 26-11-2001                    |
|  |   |                               | WO                                | 0187849 A2  | 22-11-2001                    |



WEITERE ANGABEN

PCT/ISA/ 210

Fortsetzung von Feld I.2

Die Recherche ergab in ihrer Anfangsphase eine sehr große Zahl neuheitsschädlicher Verbindungen für Anspruch 1. Diese Zahl ist so groß, daß sich unmöglich feststellen lässt, für was in der Gesamtheit der Patentansprüche eventuell nach zu Recht Schutz begehrt werden könnte (Art. 6 PCT). Aus diesen Gründen erscheint eine sinnvolle Recherche über den gesamten Bereich der Patentansprüche unmöglich. Die Recherche wurde daher beschränkt auf:

Die Verbindungen (I) wie in Anspruch 1 definiert, bei denen der gewählte Ausdruck "Bioisoster" (verwendet in der Definition von R) nur die in diesem Anspruch tatsächlich darin aufgeführten Gruppierungen (d.h. -C(=A)-E sowie die auf Seite 188 angegebenen Strukturformeln) repräsentiert

Der Anmelder wird darauf hingewiesen, daß Patentansprüche, oder Teile von Patentansprüchen, auf Erfindungen, für die kein internationaler Recherchenbericht erstellt wurde, normalerweise nicht Gegenstand einer internationalen vorläufigen Prüfung sein können (Regel 66.1(e) PCT). In seiner Eigenschaft als mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde wird das EPA also in der Regel keine vorläufige Prüfung für Gegenstände durchführen, zu denen keine Recherche vorliegt. Dies gilt auch für den Fall, daß die Patentansprüche nach Erhalt des internationalen Recherchenberichtes geändert wurden (Art. 19 PCT), oder für den Fall, daß der Anmelder im Zuge des Verfahrens gemäß Kapitel II PCT neue Patentansprüche vorlegt.